

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. Mai 2004 (06.05.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/037787 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 207/26,
207/24, A01N 43/34

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/011557

(22) Internationales Anmeldedatum:
17. Oktober 2003 (17.10.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 48 700.6 18. Oktober 2002 (18.10.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): REINHARD, Robert [DE/DE]; Wieland-Str. 30, 67065 Ludwigshafen (DE). HAMPRECHT, Gerhard [DE/DE]; Rote-Turm-Str. 26, 69469 Weinheim (DE). PUHL, Michael [DE/DE]; Bürsfelder-Str. 95, 68623 Lampertheim (DE). SEITZ, Werner [DE/DE]; Bismarckstr. 22b, 68723 Plankstadt (DE). PARRA RAPADO, Liliana [ES/DE]; S6, 29-31, 68161 Mannheim (DE). SCANNELL-LANSKY, Annegret [DE/DE]; Gerhardt-Hauptmann-Str. 15, 64319 Pfungstadt (DE). GROSSMANN, Klaus [DE/DE]; Mainstr. 1, 67141 Neuhofen (DE). SCHIFFER, Helmut

[DE/DE]; Am Hofstück 25, 67483 Grossfischlingen (DE). WITSCHHEL, Matthias [DE/DE]; Hohenweg 12b, 67098 Bad Dürkheim (DE). ZAGAR, Cyril [DE/DE]; Untere Clignetstr. 8, 68167 Mannheim (DE). LANDES, Andreas [DE/DE]; Grünwaldstr. 15, 67354 Römerberg-Heiligenstein (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123 Heidelberg (DE).

(74) Anwalt: POHL, Michael; Reitstötter, Kinzebach & Partner, Ludwigsplatz 4, 67059 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

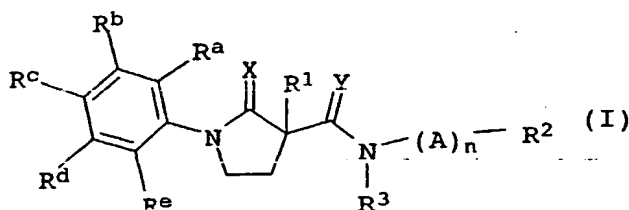
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 1-PHENYLPYRROLIDINE-2-ONE-3-CARBOXAMIDES

(54) Bezeichnung: 1-PHENYLPYRROLIDIN-2-ON-3-CARBOXAMIDE



(57) Abstract: The invention relates to 1-phenylpyrrolidine-2-one-3-carboxamides of general formula (I), wherein variables R¹, R², R³, X, Y, A, n, R^a, R^b, R^c, R^d and R^e have the meanings as cited in Claim 1, and to agriculturally usable salts thereof. The invention also relates to: the use of compounds I and/or the salts thereof as herbicides; plant protection products containing, as active substances, at least one 1-phenylpyrrolidine-2-one-3-carboxamide of formula (I) and/or at least one agriculturally usable salt of

formula (I), and; a method for controlling unwanted plant growth during which a herbicidally effective amount of at least one 1-phenylpyrrolidine-2-one-3-carboxamide of formula (I) or of an agriculturally usable salt of formula (I) is permitted to act upon plants, the habitat thereof or upon seeds.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der allgemeinen Formel (I), worin die Variablen R¹, R², R³, X, Y, A, n, R^a, R^b, R^c, R^d und R^e die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze: Ausserdem betrifft die Erfindung - die Verwendung von Verbindungen I und/oder ihrer Salze als Herbizide; - Pflanzenschutzmittel, welche mindestens ein 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamid der Formel (I) und/oder mindestens ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I als wirksame Substanzen enthalten; sowie - Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, bei dem man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamids der Formel (I) oder eines landwirtschaftlichen Salzes von I auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken lässt.

WO 2004/037787 A1



Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide

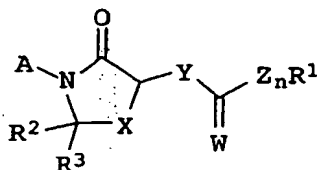
Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Mittel die derartige Verbindungen enthalten sowie die Verwendung der 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide, ihrer Salze oder Mittel, 10 die diese enthalten, als Herbizide.

Die WO 95/33719 beschreibt 1-Arylthiazolidinone, 1-Aryloxazolidinone und 1-Arylpyrrolidinone der allgemeinen Formel:

15



20

worin A einen aromatischen oder heteroaromatischen Rest bedeutet, n für 0 oder 1 steht, X insbesondere S, O oder CH₂ bedeutet, Y insbesondere für S, O, CH₂ oder CH(CH₃) oder eine Gruppe NR⁶ steht, Z insbesondere NH oder O bedeutet, R¹ vorzugsweise ausgewählt ist unter gegebenenfalls substituiertem Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, gegebenenfalls substituiertem Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertem Phenyl, Benzyl oder Hetaryl, Acyl, Alkoxy-carbonylalkyl und Silyl, R² und R³ insbesondere Wasserstoff bedeuten und R⁶ unter anderem für Wasserstoff, Formyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht. 25

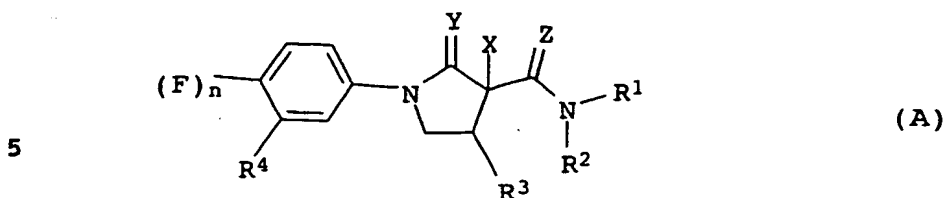
In der WO 95/33718 werden 1-Phenylpyrrolidinthione mit herbizider Wirksamkeit beschrieben, die in der 3-Position des Pyrrolidin-thionrings eine Gruppe O-C(O)-NR¹R² aufweisen, worin R¹R² beispielsweise für Wasserstoff, einen gegebenenfalls substituierten Kohlenwasserstoffrest oder Hetaryl stehen, oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Heterocyclus bilden. 35

40

Weiterhin sind aus der US 4,874,422 herbizid wirksame 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel A bekannt, 45

45

2

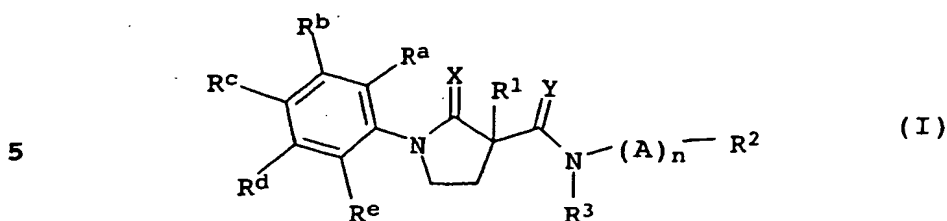


worin X für Wasserstoff oder Halogen steht, Y und Z unabhängig
 10 voneinander O oder S bedeuten, n für 0 oder 1 steht, R¹ Wasser-
 stoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Phenyl, Halo-
 genphenyl, Benzyl, Halogenbenzyl, oder Alkyl bedeutet, das mit
 Alkoxy, Alkylthio, Phenyl, Hydroxy oder Cyano substituiert ist, R²
 Wasserstoff oder Alkyl bedeutet, R³ für Alkyl oder Alkenyl steht
 15 und R⁴ ausgewählt ist unter Wasserstoff, Halogen, Methyl, Triflu-
 ormethyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyloxy,
 Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylsulfanyl, Methylsulfinyl,
 Methylsulfonyl, Methoxyiminomethyl, Methoxyimino-1-ethyl, Benzy-
 loxyiminomethyl und Benzyloxyimino-1-ethyl.

20 Die herbizide Wirksamkeit der im Stand der Technik beschriebenen
 1-Arylpyrrolidinone ist nicht immer zufriedenstellen. Auch ihre
 Selektivität gegenüber Schadpflanzen lässt zu wünschen übrig.
 Insbesondere neigen derartige Herbizide bereits bei geringen Auf-
 25 wandmengen dazu, die Blattgrünbildung auch in Kulturpflanzen zu
 stören, was grundsätzlich unerwünscht ist und zu Ertragseinbußen
 führen kann.

Der vorliegenden Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, neue
 30 herbizid wirksame Verbindungen bereitzustellen, mit denen sich
 unerwünschte Pflanzen besser als mit den bekannten Herbiziden ge-
 zielt bekämpfen lassen. Die neuen Herbizide sollen vorteilhafter-
 weise eine hohe Aktivität gegenüber Schadpflanzen aufweisen. Au-
 ßerdem ist eine hohe Kulturpflanzenverträglichkeit erwünscht. Zu-
 35 dem sollten sie die Blattgrünsynthese in Kulturpflanzen nicht
 nachteilig beeinflussen.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass diese Aufgabe
 durch 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der nachstehend defi-
 40 nierten allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich brauch-
 baren Salze gelöst wird:



worin die Variablen R^1 , R^2 , R^3 , X , Y , A , n , R^a , R^b , R^c , R^d und R^e
 10 folgende Bedeutung haben:

R^1 Wasserstoff, OH, Cl, Br, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, $C(O)R^4$ oder $OC(O)R^4$;

15 R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, C_7 - C_{10} -Polycycloalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Alkinyl, C_5 - C_{10} -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, Phenyl oder 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl, wobei die 9 letztge-
 20 nannten Gruppen unsubstituiert, teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Reste, ausgewählt unter OH, CN, NO_2 , COOH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, $COOR^5$, NR^6R^7 , $C(O)NR^8SO_2R^{13}$,
 25 $C(O)NR^8R^9$ und 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl aufweisen können und jedes Heterocyclyl 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel, einer Gruppe NR^{10} und einer Gruppe SO_2 , sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3
 30 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann und/oder einen anellierten Phenylring aufweisen kann, der gegebenenfalls substituiert ist; oder

R^2 und R^3 mit der Gruppe $N-(A)_n$, an die sie gebunden sind, einen gesättigten, 3 bis 7 gliedrigen Heterocyclus bilden, der
 35 neben dem Stickstoffatom 1, 2 oder weitere 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel und einer Gruppe NR^{10} sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann;

40 R^a , R^b , R^c , R^d und R^e unabhängig voneinander Wasserstoff, OH, CN, NO_2 , Halogen, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, $C(O)R^4$, $COOR^5$, NR^6R^7 , $C(O)NR^8R^9$, $S(O)_2NR^8R^9$, $S(O)R^{11}$,
 45 $S(O)_2R^{11}$ oder C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl; oder

4

zwei benachbarte Reste R^a bis R^e bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring, der ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel und einer Gruppe NR^{10} als ringbildendes Atom enthalten kann und/oder ein, zwei, drei oder vier Reste ausgewählt unter Halogen und C_1 - C_4 -Alkyl tragen kann;

X,Y unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel;

10

n 0 oder 1;

A O, $S(O)_k$ oder NR^{12} , worin k für 0, 1 oder 2;

15 R^4, R^8, R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;

R^5, R^{11} C_1 - C_4 -Alkyl;

20 R^6, R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, $C(O)R^4$, $COOR^5$ oder $S(O)_2R^{11}$;

R^{10}, R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkinyl; und

25 R^{13} Phenyl, das unsubstituiert ist oder eine 1, 2, 3 oder 4 Substituenten trägt, wobei die Substituenten ausgewählt sind unter Halogen, Nitro, Cyano, OH, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, $COOR^5$, $NR^{6,7}$ und $C(O)NR^{8,9}$.

30 Die vorliegende Erfindung betrifft demnach 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der allgemeinen Formel I sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

Außerdem betrifft die Erfindung

- 35 - die Verwendung von Verbindungen I und/oder ihrer Salze als Herbizide;
- Pflanzenschutzmittel, welche mindestens ein 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamid der Formel I und/oder mindestens ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I als wirksame Substanzen enthalten; sowie
- 40 - Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, bei dem man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamids der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I auf Pflanzen,
- 45 deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken lässt.

5

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische. Gegenstand der Erfindung sind auch Tautomere von Verbindungen der Formel I.

Sofern R^1 für Wasserstoff steht, können die erfindungsgemäßen 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel I in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Basen bzw. Kationen in Betracht, welche die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als basische Salze insbesondere diejenigen der Alkalimetalle, vorzugsweise des Natriums und des Kaliums, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise des Calciums, Magnesiums und Bariums, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise des Mangans, Kupfers, Zinks und Eisens, sowie Ammoniumsalze, bei denen das Ammoniumion gewünschtenfalls ein bis vier C_1 - C_4 -Alkylsubstituenten, C_1 - C_4 -Hydroxylalkylsubstituenten, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetra-butylammonium, Trimethylbenzylammonium, Trimethyl-2-hydroxyethylammonium, Bis-(2-hydroxyethyl)methylammonium, Tris(2-hydroxyethyl)ammonium, Bis-(2-hydroxyethyl)dimethylammonium, Tris(2-hydroxyethyl)methylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C_1 - C_4 -alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C_1 - C_4 -alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Die bei der Definition der Substituenten R^1 bis R^{12} oder als Reste an heterocyclischen Ringen genannten organischen Molekülteile stellen - wie die Bedeutung Halogen - Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Cyanoalkyl-, Aminoalkyl-, Aminocarbonylalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Alkinyl, Alkenyl-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

40

Ferner stehen beispielsweise:

- C_1 - C_4 -Alkyl für: z. B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl oder 1,1-Dimethylethyl;

45

6

- 5 — C₁-C₆-Alkyl für: C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie
z. B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl,
2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl,
1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl,
10 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl,
1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl,
2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl,
2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl
oder 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 15 — C₁-C₁₀-Alkyl für: C₁-C₆-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie
z. B. n-Heptyl, 2-Heptyl, 2-Methylhexyl, n-Octyl, 1-Methyl-
heptyl, 2-Ethylhexyl, n-Nonyl, 2-Nonyl, n-Decyl, 2-Decyl,
2-Propylheptyl und dergleichen;
- 20 — C₁-C₄-Halogenalkyl für: einen C₁-C₄-Alkylrest, wie vorstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Chlormethyl,
Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,
25 Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl,
Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,
2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,
2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,
2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl,
30 Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl,
2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl,
3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl,
3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl,
2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl,
1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl,
1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl,
4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl; insbesondere für
Difluormethyl, Trifluormethyl;
- 35 — C₁-C₆-Halogenalkyl: C₁-C₄-Halogenalkyl, wie vorstehend
genannt, sowie für 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl,
5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl,
6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl oder Dodecafluorhexyl;
- 40 — C₁-C₂-Fluoralkyl: für C₁-C₂-Alkyl, das 1, 2, 3, 4 oder 5 Fluo-
ratome trägt, z.B. für Difluormethyl, Trifluormethyl,
2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,
1,1,2,2-Tetrafluorethyl und Pentafluorethyl;

7

- C₁-C₂-Fluoralkoxy: für C₁-C₂-Alkoxy, das 1, 2, 3, 4 oder 5 Fluoratome trägt, z.B. für Difluormethoxy, Trifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy und Pentafluorethoxy;
- 5 - C₁-C₄-Alkoxy für: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;
- 10 - C₁-C₆-Alkoxy: C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy,
- 15 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 20 - C₁-C₄-Halogenalkoxy für: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCH(Cl)₂, OC(Cl)₃, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy,
- 25 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder 35 Nonafluorbutoxy, vorzugsweise für OCHF₂ oder OCHF₃;
- C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkoxy - wie vorstehend genannt - substituiertes C₁-C₆-Alkyl, also z.B. für 40 CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-Propoxymethyl, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(n-Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(n-Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 45 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(n-Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(n-Butoxy)propyl,

2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl,
2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl,
3-(Ethoxy)propyl, 3-(n-Propoxy)propyl,
3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(n-Butoxy)propyl,
5 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl,
3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl,
2-(Ethoxy)butyl, 2-(n-Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl,
2-(n-Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl,
2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl,
10 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(n-Propoxy)butyl,
3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(n-Butoxy)butyl,
3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl,
3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl,
4-(Ethoxy)butyl, 4-(n-Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl,
15 4-(n-Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl,
4-(2-Methylpropoxy)butyl, 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl,
2-(1-Methylethoxy)pentyl, 2-(n-Butoxy)pentyl, 2-(1-Methyl-
propoxy)pentyl, 2-(2-Methylpropoxy)pentyl, 2-(1,1-Dimethyl-
ethoxy)pentyl, 3-(Methoxy)pentyl, 3-(Ethoxy)pentyl, 3-(n-
20 Propoxy)pentyl, 3-(1-Methylethoxy)pentyl, 3-(n-Butoxy)pentyl,
3-(1-Methylpropoxy)pentyl, 3-(2-Methylpropoxy)pentyl,
3-(1,1-Dimethylethoxy)pentyl, 4-(Methoxy)pentyl,
4-(Ethoxy)pentyl, 4-(n-Propoxy)pentyl, 4-(1-Methylethoxy)pen-
25 tyl, 4-(n-Butoxy)pentyl, 4-(1-Methylpropoxy)pentyl,
4-(2-Methylpropoxy)pentyl, 4-(1,1-Dimethylethoxy)pentyl,
4-(Methoxy)pentyl, 5-(Ethoxy)pentyl, 5-(n-Propoxy)pentyl,
5-(1-Methylethoxy)pentyl, 5-(n-Butoxy)pentyl, 5-(1-Methyl-
propoxy)pentyl, 5-(2-Methylpropoxy)pentyl, 5-(1,1-Dimethyl-
30 ethoxy)pentyl, 2-(1-Methylethoxy)hexyl, 2-(n-Butoxy)hexyl,
2-(1-Methylpropoxy)hexyl, 2-(2-Methylpropoxy)hexyl,
2-(1,1-Dimethylethoxy)hexyl, 3-(Methoxy)hexyl, 3-(Ethoxy)he-
xyl, 3-(n-Propoxy)hexyl, 3-(1-Methylethoxy)hexyl, 3-(n-Bu-
toxy)hexyl, 3-(1-Methylpropoxy)hexyl, 3-(2-Methylpropoxy)he-
35 xyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)hexyl, 4-(Methoxy)hexyl,
4-(Ethoxy)hexyl, 4-(n-Propoxy)hexyl, 4-(1-Methylethoxy)hexyl,
4-(n-Butoxy)hexyl, 4-(1-Methylpropoxy)hexyl,
4-(2-Methylpropoxy)hexyl, 4-(1,1-Dimethylethoxy)hexyl,
4-(Methoxy)hexyl, 5-(Ethoxy)hexyl, 5-(n-Propoxy)hexyl,
40 5-(1-Methylethoxy)hexyl, 5-(n-Butoxy)hexyl, 5-(1-Methyl-
propoxy)hexyl, 5-(2-Methylpropoxy)hexyl, 5-(1,1-Dimethyl-
ethoxy)hexyl, 6-(Ethoxy)hexyl, 6-(n-Propoxy)hexyl,
6-(1-Methylethoxy)hexyl, 6-(n-Butoxy)hexyl, 6-(1-Methyl-
propoxy)hexyl, 6-(2-Methylpropoxy)hexyl, 6-(1,1-Dimethyl-
45 ethoxy)hexyl;

- C₁-C₄-Alkylthio: für einen Alkylsulfanyl-Rest mit 1 bis 4 C-Atomen, z. B. SCH₃, SC₂H₅, SCH₂-C₂H₅, SCH(CH₃)₂, n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃;
- 5 - C₁-C₆-Alkylthio: für C₁-C₄-Alkylthio, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 10 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 15 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio oder 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- C₁-C₄-Halogenalkylthio für: einen C₁-C₄-Alkylthioest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. 20 Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 25 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 30 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 35 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio oder Nonafluorbutylthio;
- Phenyl-C₁-C₄-alkyl für: z. B. Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, 1-Phenylprop-1-yl, 2-Phenylprop-1-yl, 40 3-Phenylprop-1-yl, 1-Phenylbut-1-yl, 2-Phenylbut-1-yl, 3-Phenylbut-1-yl, 4-Phenylbut-1-yl, 1-Phenylbut-2-yl, 2-Phenylbut-2-yl, 3-Phenylbut-2-yl, 4-Phenylbut-2-yl, 1-(Benzyl)eth-1-yl, 1-(Benzyl)-1-(methyl)eth-1-yl oder 1-(Benzyl)prop-1-yl;

10

- C₂-C₆-Alkenyl für: einen einfach ungesättigten aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 2 bis 6 und insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, z. B. Ethenyl, Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methylethenyl, Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, Penten-1-yl, Penten-2-yl, Penten-3-yl, Penten-4-yl, 1-Methyl-but-1-en-1-yl, 2-Methyl-but-1-en-1-yl, 3-Methyl-but-1-en-1-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl, Hex-1-en-1-yl, Hex-2-en-1-yl, Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl, 3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methyl-pent-2-en-1-yl, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- C₃-C₈-Alkenyl für: einen eine C=C-Doppelbindung enthaltenden aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 8, vorzugsweise 3 bis 6 und insbesondere 3 oder 4 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, der vorzugsweise nicht über ein C-Atom der Doppelbindung gebunden ist, z.B. für einen der unter C₂-C₆-Alkenyl genannten Reste sowie für 1-Hepten-3-yl, 1-Hepten-4-yl, 1-Hepten-5-yl, 1-Hepten-6-yl, 1-Hepten-7-yl, 3-Hepten-1-yl, 2-Hepten-4-yl, 3-Hepten-5-yl, 3-Hepten-6-yl, 3-Hepten-7-yl, 1-Octen-3-yl, 1-Octen-4-yl, 1-Octen-5-yl, 1-Octen-6-yl,

11

- 1-Octen-7-yl, 1-Octen-8-yl, 3-Octen-1-yl, 2-Octen-1-yl, 2-Octen-4-yl, 3-Octen-5-yl, 3-Octen-6-yl, 3-Octen-7-yl, 3-Octen-8-yl und dergleichen;
- 5 - C₂-C₆-Halogenalkenyl für: C₂-C₆-Alkenyl wie vorstehend genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiert ist, also z.B. 2-Chlorvinyl, 2-Chlorallyl, 3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl, 3,3-Dichlorallyl, 2,3,3-Trichlorallyl, 2,3-Dichlorbut-2-enyl, 10 2-Bromallyl, 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl, 2,3,3-Tribromallyl und 2,3-Dibrombut-2-enyl;
- C₂-C₆-Alkinyl für: einen eine C-C-Dreifachbindung enthaltenden aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 2 bis 6 und insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatomen: z. B. Ethinyl, Propargyl 15 (2-Propinyl), 1-Propinyl, But-1-in-3-yl, But-1-in-4-yl, But-2-in-1-yl, Pent-1-in-3-yl, Pent-1-in-4-yl, Pent-1-in-5-yl, Pent-2-in-1-yl, Pent-2-in-4-yl, Pent-2-in-5-yl, 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl, Hex-1-in-3-yl, Hex-1-in-4-yl, Hex-1-in-5-yl, 20 Hex-1-in-6-yl, Hex-2-in-1-yl, Hex-2-in-4-yl, Hex-2-in-5-yl, Hex-2-in-6-yl, Hex-3-in-1-yl, Hex-3-in-2-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl, 3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder 4-Methyl-pent-2-in-5-yl; 25
- C₃-C₁₀-Alkinyl für: einen eine Dreifachbindung enthaltenden aliphatischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 10 [8], vorzugsweise 3 bis 6 und insbesondere 3 oder 4 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, der vorzugsweise nicht über ein C-Atom der Dreifachbindung gebunden ist, z.B. für einen der unter C₂-C₆-Alkinyl genannten Reste sowie für 1-Heptin-3-yl, 1-Heptin-4-yl, 1-Heptin-5-yl, 1-Heptin-6-yl, 1-Heptin-7-yl, 3-Heptin-1-yl, 2-Heptin-4-yl, 3-Heptin-5-yl, 3-Heptin-6-yl, 35 3-Heptin-7-yl, 1-Octin-3-yl, 1-Octin-4-yl, 1-Octin-5-yl, 1-Octin-6-yl, 1-Octin-7-yl, 1-Octin-8-yl, 3-Octin-1-yl, 2-Octin-1-yl, 2-Octin-4-yl, 3-Octin-5-yl, 3-Octin-6-yl, 3-Octin-7-yl, 3-Octin-8-yl und dergleichen;
- 40 - C₃-C₁₀-Cycloalkyl: monocyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 10 C-Atomen, insbesondere 3 bis 8 C-Atomen und speziell 3 bis 6 C-Atomen, z. B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl;
- 45 C₇-C₁₀-Polycycloalkyl: bicyclischer, tricyclischer oder tetracyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 7 bis 10 Kohlenstoffatomen, z. B. Bicyclo-[2.2.1]-hept-1-yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-2-

12

yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-7-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-1-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-2-yl oder Adamantan-1-yl;

- C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl für C₁-C₄-Alkyl, das einen
- 5 C₃-C₈-Cycloalkylrest wie oben definiert trägt, z.B. für Cyclopropylmethyl, 1-Cyclopropyl-ethyl, 2-Cyclopropyl-ethyl, 1-Cyclopropyl-prop-1-yl, 2-Cyclopropyl-prop-1-yl, 3-Cyclopropyl-prop-1-yl, 1-Cyclopropyl-but-1-yl, 2-Cyclopropyl-but-1-yl, 3-Cyclopropyl-but-1-yl, 4-Cyclopropyl-but-1-yl, 1-Cyclopropyl-but-2-yl, 2-Cyclopropyl-but-2-yl, 3-Cyclopropyl-but-2-yl, 4-Cyclopropyl-but-2-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-prop-1-yl, Cyclobutylmethyl, 1-Cyclobutyl-ethyl, 2-Cyclobutyl-ethyl, 1-Cyclobutyl-prop-1-yl, 2-Cyclobutyl-prop-1-yl, 3-Cyclobutyl-prop-1-yl, 1-Cyclobutyl-but-1-yl, 2-Cyclobutyl-but-1-yl, 3-Cyclobutyl-but-1-yl, 4-Cyclobutyl-but-1-yl, 1-Cyclobutyl-but-2-yl, 2-Cyclobutyl-but-2-yl, 3-Cyclobutyl-but-2-yl, 4-Cyclobutyl-but-2-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-prop-1-yl, Cyclopentylmethyl, 1-Cyclopentyl-ethyl, 2-Cyclopentyl-ethyl, 1-Cyclopentyl-prop-1-yl, 2-Cyclopentyl-prop-1-yl, 3-Cyclopentyl-prop-1-yl, 1-Cyclopentyl-but-1-yl, 2-Cyclopentyl-but-1-yl, 3-Cyclopentyl-but-1-yl, 4-Cyclopentyl-but-1-yl, 1-Cyclopentyl-but-2-yl, 2-Cyclopentyl-but-2-yl, 3-Cyclopentyl-but-2-yl, 4-Cyclopentyl-but-2-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-prop-1-yl, Cyclohexylmethyl, 1-Cyclohexyl-ethyl, 2-Cyclohexyl-ethyl, 1-Cyclohexyl-prop-1-yl, 2-Cyclohexyl-prop-1-yl, 3-Cyclohexyl-prop-1-yl, 1-Cyclohexyl-but-1-yl, 2-Cyclohexyl-but-1-yl, 3-Cyclohexyl-but-1-yl, 4-Cyclohexyl-but-1-yl, 1-Cyclohexyl-but-2-yl, 2-Cyclohexyl-but-2-yl, 3-Cyclohexyl-but-2-yl, 4-Cyclohexyl-but-2-yl, 1-(Cyclohexylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclohexylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclohexylmethyl)-prop-1-yl, Cycloheptylmethyl, 1-Cycloheptyl-ethyl, 2-Cycloheptyl-ethyl, 1-Cycloheptyl-prop-1-yl, 2-Cycloheptyl-prop-1-yl, 3-Cycloheptyl-prop-1-yl, 1-Cycloheptyl-but-1-yl, 2-Cycloheptyl-but-1-yl, 3-Cycloheptyl-but-1-yl, 4-Cycloheptyl-but-1-yl, 1-Cycloheptyl-but-2-yl, 2-Cycloheptyl-but-2-yl, 3-Cycloheptyl-but-2-yl, 4-Cycloheptyl-but-2-yl, 1-(Cycloheptylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cycloheptylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cycloheptylmethyl)-prop-1-yl, Cyclooctylmethyl, 1-Cyclooctyl-ethyl, 2-Cyclooctyl-ethyl, 1-Cyclooctyl-prop-1-yl, 2-Cyclooctyl-prop-1-yl, 3-Cyclooctyl-prop-1-yl, 1-Cyclooctyl-but-1-yl, 2-Cyclooctyl-but-1-yl, 3-Cyclooctyl-

13

but-1-yl, 4-Cyclooctyl-but-1-yl, 1-Cyclooctyl-but-2-yl, 2-Cyclooctyl-but-2-yl, 3-Cyclooctyl-but-2-yl, 4-Cyclooctyl-but-2-yl, 1-(Cyclooctylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclooctylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder 1-(Cyclooctylmethyl)-prop-1-yl, vorzugsweise für Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

— C₅-C₁₀-Cycloalkenyl: mono- oder bicyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 5 bis 10 C-Atomen, insbesondere 5 bis 8 C-Atomen und speziell 5 bis 6 C-Atomen, der eine C=C-Doppelbindung aufweist, z B. Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl, Cyclohexen-4-yl, Cyclohepten-1-yl, Cyclohepten-3-yl, Cyclohepten-4-yl, Cycloocten-1-yl, Cycloocten-3-yl, Cycloocten-4-yl, Cycloocten-5-yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-2-en-1-yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-2-en-2-yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-2-en-5-yl, Bicyclo-[2.2.1]hept-2-en-7-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-2-en-1-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-2-en-2-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-2-en-5-yl, Bicyclo-[2.2.2]oct-2-en-7-yl;

— gegebenenfalls substituiertes Phenyl: eine unsubstituierte oder eine 1, 2, 3 oder 4 Substituenten tragende Phenylgruppe, wobei die Substituenten ausgewählt sind unter Halogen, Nitro, Cyano, OH, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹;

— 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl: ein heterocyclischer Rest, der 3, 4, 5, 6 oder 7 Ringglieder aufweist, wobei 1, 2 oder 3 der Ringglieder Heteroatome sind, die ausgewählt sind unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel, einer Gruppe SO₂ und einer Gruppe NR¹⁰. Außerdem kann der Heterocyclus gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen. Der Heterocyclus kann außerdem einen anellierten, gegebenenfalls substituierten Phenylring aufweisen. Der Heterocyclus kann aromatisch sein (Heteroaryl) oder teilweise oder vollständig gesättigt sein.

Beispiele für gesättigte Heterocyclen sind:

Oxiran-1-yl, Aziridin-1-yl, Oxetan-2-yl, Oxetan-3-yl, Thietan-2-yl, Thietan-3-yl, Azetidin-1-yl, Azetidin-2-yl, Azetidin-3-yl, Tetrahydrofuran-2-yl, Tetrahydrofuran-3-yl, Tetrahydrothiophen-2-yl, Tetrahydrothiophen-3-yl, Pyrrolidin-1-yl, Pyrrolidin-2-yl, Pyrrolidin-3-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-5-yl, 1,3-Oxazolidin-2-yl, 1,3-Oxazolidin-3-yl, 1,3-Oxazolidin-4-yl, 1,3-Oxazolidin-5-yl, 1,2-Oxazolidin-2-yl, 1,2-Oxazolidin-3-yl, 1,2-Oxazolidin-4-yl,

14

1,2-Oxazolidin-5-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl, Pyrrolidin-1-yl, Pyrrolidin-2-yl, Pyrrolidin-5-yl, Tetrahydropyrazol-1-yl, Tetrahydropyrazol-3-yl, Tetrahydropyrazol-4-yl, Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Piperidin-1-yl, Piperidin-2-yl, Piperidin-3-yl, Piperidin-4-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Dioxan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Oxathian-4-yl, 1,3-Oxathian-5-yl, 1,3-Oxathian-6-yl, 1,4-Oxathian-2-yl, 1,4-Oxathian-3-yl, Morpholin-2-yl, Morpholin-3-yl, Morpholin-4-yl, Hexahydropyridazin-1-yl, Hexahydropyridazin-3-yl, Hexahydropyridazin-4-yl, Hexahydropyrimidin-1-yl, Hexahydropyrimidin-2-yl, Hexahydropyrimidin-4-yl, Hexahydropyrimidin-5-yl, Piperazin-1-yl, Piperazin-2-yl, Piperazin-3-yl, Hexahydro-1,3,5-triazin-1-yl, Hexahydro-1,3,5-triazin-2-yl, Oxepan-2-yl, Oxepan-3-yl, Oxepan-4-yl, Thiepan-2-yl, Thiepan-3-yl, Thiepan-4-yl, 1,3-Dioxepan-2-yl, 1,3-Dioxepan-4-yl, 1,3-Dioxepan-5-yl, 1,3-Dioxepan-6-yl, 1,3-Dithiepan-2-yl, 1,3-Dithiepan-4-yl, 1,3-Dithiepan-5-yl, 1,3-Dithiepan-6-yl, 1,4-Dioxepan-2-yl, 1,4-Dioxepan-7-yl, Hexahydroazepin-1-yl, Hexahydroazepin-2-yl, Hexahydroazepin-3-yl, Hexahydroazepin-4-yl, Hexahydro-1,3-diazepin-1-yl, Hexahydro-1,3-diazepin-2-yl, Hexahydro-1,3-diazepin-4-yl, Hexahydro-1,4-diazepin-1-yl und Hexahydro-1,4-diazepin-2-yl;

Beispiele für ungesättigte Heterocyclen sind:

Dihydrofuran-2-yl, 1,2-Oxazolin-3-yl, 1,2-Oxazolin-5-yl, 1,3-Oxazolin-2-yl;

30

Beispiele für aromatisches Heterocyclen sind die 5- und 6-gliedrigen aromatischen, heterocyclischen Reste, z.B. Furyl wie 2-Furyl und 3-Furyl, Thienyl wie 2-Thienyl und 3-Thienyl, Pyrrolyl wie 2-Pyrrolyl und 3-Pyrrolyl, Isoxazolyl wie 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl und 5-Isoxazolyl, Isothiazolyl wie 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl und 5-Isothiazolyl, Pyrazolyl wie 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl und 5-Pyrazolyl, Oxazolyl wie 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl und 5-Oxazolyl, Thiazolyl wie 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl und 5-Thiazolyl, Imidazolyl wie 2-Imidazolyl und 4-Imidazolyl, Oxadiazolyl wie 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl und 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, Thiadiazolyl wie 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, Triazolyl wie 1,2,4-Triazol-1-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl und 1,2,4-Triazol-4-yl, Pyridinyl wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl und 4-Pyridinyl, Pyridazinyl wie 3-Pyridazinyl und 4-Pyridazinyl, Pyrimidinyl wie 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl und 5-Pyrimidinyl, des weiteren 2-Pyrazi-

45

nyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl, insbesondere Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl und Thienyl.

Sofern die Reste R^2 und R^3 mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten Heterocyclus bilden, steht n vorzugsweise für 0. Der gesättigte Heterocyclus ist dann beispielsweise ausgewählt unter 1,3-Oxazolidin-3-yl, 1,2-Oxazolidin-2-yl, Pyrrolidin-1-yl, Pyrrolidin-2-on-1-yl, Tetrahydropyrazol-1-yl, 2-Methyltetrahydropyrazol-1-yl, Piperidin-1-yl, Piperidin-2-on-1-yl, Morpholin-4-yl, Hexahydropyrimidin-1-yl, Piperazin-1-yl, 4-Methylpiperazin-1-yl, Hexahydro-1,3,5-triazin-1-yl, 3,5-Dimethyltriazin-1-yl, Hexahydroazepin-1-yl, Hexahydroazepin-2-on-1-yl, Hexahydro-1,3-diazepin-1-yl, Hexahydro-1,4-diazepin-1-yl, insbesondere unter Pyrrolidin-1-yl, Piperidin-1-yl und Morpholin-4-yl.

Sofern zwei benachbarte Reste R^a bis R^e gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel und einer Gruppe NR^{10} als ringbildende(s) Atom(e) enthalten kann und/oder ein, zwei, drei oder vier Reste ausgewählt unter Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl tragen kann, stehen zwei benachbarte Reste R^a bis R^e , beispielsweise R^b und R^c oder R^c und R^d , zusammen für eine 3-, 4- oder 5-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte Kohlenstoffkette, worin ein oder zwei nicht benachbarte Kohlenstoffatome der Kette durch Heteroatome, ausgewählt unter O, N, einer Gruppe NR^{10} und S, ersetzt sein können und worin die Kohlenstoffatome der Kette ein, zwei, drei oder vier Substituenten, die ausgewählt sind unter Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl, tragen können. Beispielsweise können zwei benachbarte Reste R^a bis R^e für eine Kette der Formel $-O-CH_2-O-$, $-O-(CH_2)_2-O-$, $-O-(CH_2)_2-$, $-O-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$ oder $-(CH_2)_5-$ stehen.

Im Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen R^1 , R^2 , R^3 , X, Y, A, n, R^a , R^b , R^c , R^d und R^e vorzugsweise die folgenden Bedeutungen, und zwar unabhängig voneinander und insbesondere in Kombination:

R^1 Wasserstoff, OH, Cl, Br, C_1 - C_6 -Alkyl oder $OC(O)R^4$, besonders bevorzugt Wasserstoff;

R^2 C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_8 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl wobei C_1 - C_{10} -Alkyl und C_3 - C_8 -Cycloalkyl teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen oder zwei Reste, ausgewählt unter C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Haloge-

nalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹ aufweisen kann, Phenyl das gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, Nitro, OH, CN, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹ aufweisen kann. Insbesondere steht R² für C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl, wobei C₁-C₆-Alkyl und C₃-C₆-Cycloalkyl teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen oder zwei, insbesondere einen Rest, ausgewählt unter C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹ aufweisen kann. Besonders bevorzugt steht R² für C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl;

R³ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

X Sauerstoff;

Y Sauerstoff; und

25 A sofern vorhanden Sauerstoff, eine Gruppe N-R¹² mit R¹² = Wasserstoff oder Alkyl oder eine Gruppe SO₂;

n für 0;

30 R^a, R^b, R^c, R^d, R^e Wasserstoff, Halogen, CN, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, insbesondere Halogen, CN, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Fluoralkyl und C₁-C₂-Fluoralkoxy und speziell, Fluor, Chlor, Brom, CN, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, CF₃, CHF₂, OCF₃ und OCHF₂.

35

Im Hinblick auf die Verwendung als Herbizide sind erfindungsgemäße 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel I bevorzugt, worin nicht mehr als 3 der Reste R^a, R^b, R^c, R^d und R^e und insbesondere 3 oder 4 der vorgenannten Reste von Wasserstoff verschieden sind. Insbesondere bevorzugt sind 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel I, worin zumindest R^b und/oder R^d von Wasserstoff verschieden sind. Besonders bevorzugt bedeuten dann die übrigen Reste R^a-R^e, zumindest einer der Reste R^a und R^e und speziell beide Reste R^a und R^e Wasserstoff. Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel I, worin R^b und R^c bzw. R^d und R^c von Wasserstoff verschieden sind und die übrigen der Reste R^a-R^e Wasserstoff bedeuten. Eine andere bevorzugte Ausführ-

17

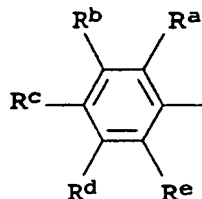
rungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, worin die Reste R^a und R^e oder R^a und R^b oder R^a und R^c von Wasserstoff verschieden sind und die übrigen der Reste R^a - R^e Wasserstoff bedeuten.

5 Bevorzugte Reste R^a , R^b , R^c , R^d , R^e sind neben Wasserstoff die Substituenten Halogen, CN, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, insbesondere Halogen, CN, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_2 -Fluoralkyl und C_1 - C_2 -Fluoralkoxy und speziell, Fluor, Chlor, Brom, CN, C_1 - C_4 -Alkyl, Methoxy, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 und $OCHF_2$.

10

Eine besonders bevorzugte Gruppe von Verbindungen der allgemeinen Formel I sind solche Verbindungen, worin R^a und R^e Wasserstoff bedeuten. Hierin steht der Rest

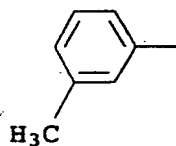
15



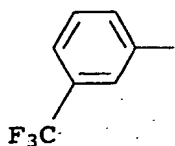
20

beispielsweise für eine Gruppe der Formeln Q1 bis Q31:

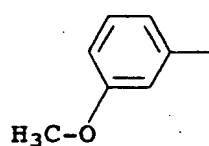
25



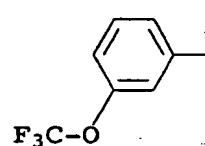
Q1



Q2

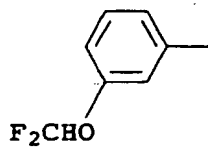


Q3

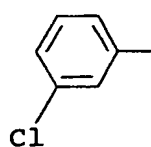


Q4

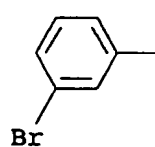
30



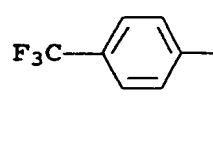
Q5



Q6

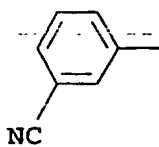


Q7

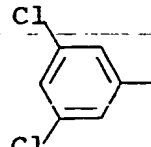


Q8

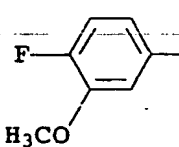
35



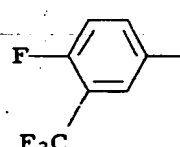
Q9



Q10

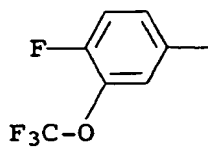


Q11

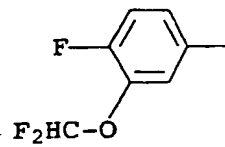


Q12

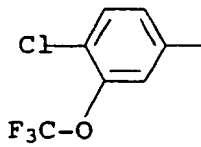
40



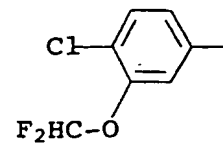
Q13



Q14



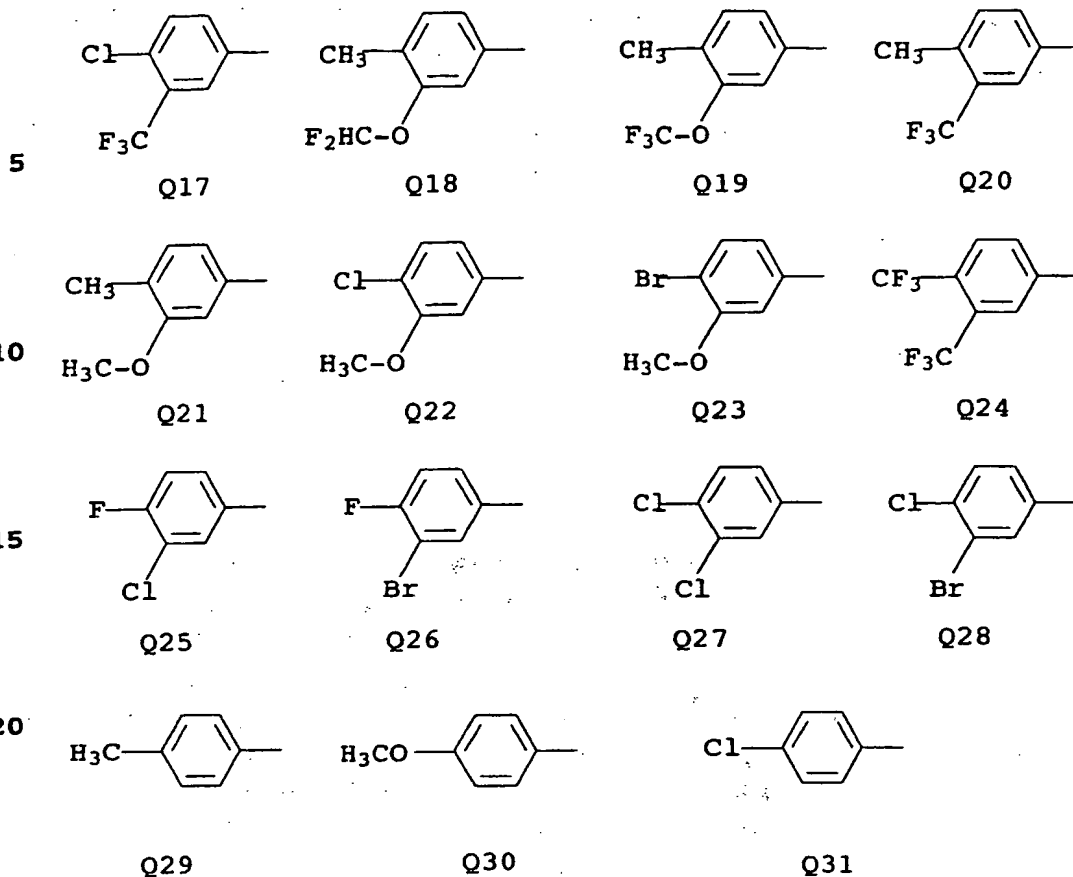
Q15



Q16

45

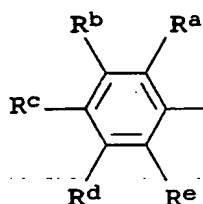
18



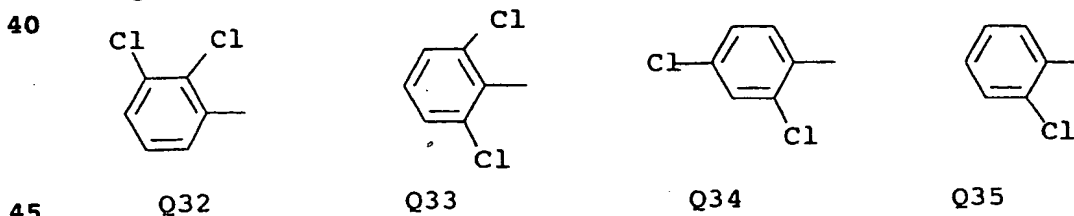
Eine andere bevorzugte Gruppe von Verbindungen der allgemeinen Formel I sind solche Verbindungen, worin R^a und gegebenenfalls einer der Reste R^b , R^c oder R^e von Wasserstoff verschieden ist und die übrigen Reste R^a - R^e Wasserstoff bedeuten. Hierin steht der

30 Rest

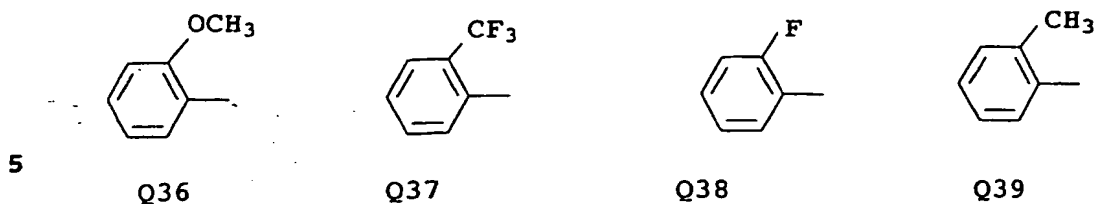
35



beispielsweise für eine Gruppe der Formeln Q32 bis Q39:

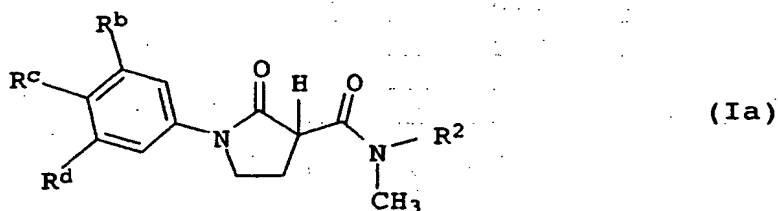


19



Besonders bevorzugt sind die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ia (\equiv I mit $R^a = R^b = H$, $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH_3$ und $n = 0$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ia.1 bis Ia.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20



25

30

35

40

45

Tabelle 1:

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	1.	Cl	H	H	H
	2.	Br	H	H	H
	3.	F	H	H	H
	4.	CH ₃	H	H	H
	5.	C ₂ H ₅	H	H	H
10	6.	CH(CH ₃) ₂	H	H	H
	7.	OCH ₃	H	H	H
	8.	CN	H	H	H
	9.	CF ₃	H	H	H
	10.	OCF ₃	H	H	H
15	11.	OCHF ₂	H	H	H
	12.	Cl	H	H	CH ₃
	13.	Br	H	H	CH ₃
	14.	F	H	H	CH ₃
	15.	CH ₃	H	H	CH ₃
20	16.	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
	17.	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
	18.	OCH ₃	H	H	CH ₃
	19.	CN	H	H	CH ₃
	20.	CF ₃	H	H	CH ₃
25	21.	OCF ₃	H	H	CH ₃
	22.	OCHF ₂	H	H	CH ₃
	23.	Cl	H	H	C ₂ H ₅
	24.	Br	H	H	C ₂ H ₅
	25.	F	H	H	C ₂ H ₅
30	26.	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
	27.	C ₂ H ₅	H	H	C ₂ H ₅
	28.	CH(CH ₃) ₂	H	H	C ₂ H ₅
	29.	OCH ₃	H	H	C ₂ H ₅
	30.	CN	H	H	C ₂ H ₅
35	31.	CF ₃	H	H	C ₂ H ₅
	32.	OCF ₃	H	H	C ₂ H ₅
	33.	OCHF ₂	H	H	C ₂ H ₅
	34.	Cl	H	H	n-C ₃ H ₇
	35.	Br	H	H	n-C ₃ H ₇
40	36.	F	H	H	n-C ₃ H ₇
	37.	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
	38.	C ₂ H ₅	H	H	n-C ₃ H ₇
	39.	CH(CH ₃) ₂	H	H	n-C ₃ H ₇
	40.	OCH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
45	41.	CN	H	H	n-C ₃ H ₇
	42.	CF ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
	43.	OCF ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
	44.	OCHF ₂	H	H	n-C ₃ H ₇
	45.	Cl	H	H	CH(CH ₃) ₂
	46.	Br	H	H	CH(CH ₃) ₂
	47.	F	H	H	CH(CH ₃) ₂

21

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
48.	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
49.	C ₂ H ₅	H	H	CH(CH ₃) ₂
50.	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH(CH ₃) ₂
51.	OCH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
52.	CN	H	H	CH(CH ₃) ₂
53.	CF ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
54.	OCF ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
55.	OCHF ₂	H	H	CH(CH ₃) ₂
56.	Cl	H	H	n-C ₄ H ₉
57.	Br	H	H	n-C ₄ H ₉
58.	F	H	H	n-C ₄ H ₉
59.	CH ₃	H	H	n-C ₄ H ₉
60.	C ₂ H ₅	H	H	n-C ₄ H ₉
61.	CH(CH ₃) ₂	H	H	n-C ₄ H ₉
62.	OCH ₃	H	H	n-C ₄ H ₉
63.	CN	H	H	n-C ₄ H ₉
64.	CF ₃	H	H	n-C ₄ H ₉
65.	OCF ₃	H	H	n-C ₄ H ₉
66.	OCHF ₂	H	H	n-C ₄ H ₉
67.	Cl	H	H	C(CH ₃) ₃
68.	Br	H	H	C(CH ₃) ₃
69.	F	H	H	C(CH ₃) ₃
70.	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
71.	C ₂ H ₅	H	H	C(CH ₃) ₃
72.	CH(CH ₃) ₂	H	H	C(CH ₃) ₃
73.	OCH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
74.	CN	H	H	C(CH ₃) ₃
75.	CF ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
76.	OCF ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
77.	OCHF ₂	H	H	C(CH ₃) ₃
78.	Cl	H	H	C ₆ H ₅
79.	Br	H	H	C ₆ H ₅
80.	F	H	H	C ₆ H ₅
81.	CH ₃	H	H	C ₆ H ₅
82.	C ₂ H ₅	H	H	C ₆ H ₅
83.	CH(CH ₃) ₂	H	H	C ₆ H ₅
84.	OCH ₃	H	H	C ₆ H ₅
85.	CN	H	H	C ₆ H ₅
86.	CF ₃	H	H	C ₆ H ₅
87.	OCF ₃	H	H	C ₆ H ₅
88.	OCHF ₂	H	H	C ₆ H ₅
89.	Cl	H	H	Cyclopropyl
90.	Br	H	H	Cyclopropyl
91.	F	H	H	Cyclopropyl
92.	CH ₃	H	H	Cyclopropyl
93.	C ₂ H ₅	H	H	Cyclopropyl
94.	CH(CH ₃) ₂	H	H	Cyclopropyl
95.	OCH ₃	H	H	Cyclopropyl
96.	CN	H	H	Cyclopropyl
97.	CF ₃	H	H	Cyclopropyl
98.	OCF ₃	H	H	Cyclopropyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	99.	OCHF ₂	H	H	Cyclopropyl
	100.	Cl	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	101.	Br	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	102.	F	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	103.	CH ₃	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
10	104.	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	105.	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	106.	OCH ₃	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	107.	CN	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	108.	CF ₃	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
15	109.	OCF ₃	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	110.	OCHF ₂	H	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	111.	Cl	H	H	Cyclobutyl
	112.	Br	H	H	Cyclobutyl
	113.	F	H	H	Cyclobutyl
20	114.	CH ₃	H	H	Cyclobutyl
	115.	C ₂ H ₅	H	H	Cyclobutyl
	116.	CH(CH ₃) ₂	H	H	Cyclobutyl
	117.	OCH ₃	H	H	Cyclobutyl
	118.	CN	H	H	Cyclobutyl
25	119.	CF ₃	H	H	Cyclobutyl
	120.	OCF ₃	H	H	Cyclobutyl
	121.	OCHF ₂	H	H	Cyclobutyl
	122.	Cl	H	H	Cyclopentyl
	123.	Br	H	H	Cyclopentyl
30	124.	F	H	H	Cyclopentyl
	125.	CH ₃	H	H	Cyclopentyl
	126.	C ₂ H ₅	H	H	Cyclopentyl
	127.	CH(CH ₃) ₂	H	H	Cyclopentyl
	128.	OCH ₃	H	H	Cyclopentyl
35	129.	CN	H	H	Cyclopentyl
	130.	CF ₃	H	H	Cyclopentyl
	131.	OCF ₃	H	H	Cyclopentyl
	132.	OCHF ₂	H	H	Cyclopentyl
	133.	Cl	H	H	Cyclohexyl
40	134.	Br	H	H	Cyclohexyl
	135.	F	H	H	Cyclohexyl
	136.	CH ₃	H	H	Cyclohexyl
	137.	C ₂ H ₅	H	H	Cyclohexyl
	138.	CH(CH ₃) ₂	H	H	Cyclohexyl
45	139.	OCH ₃	H	H	Cyclohexyl
	140.	CN	H	H	Cyclohexyl
	141.	CF ₃	H	H	Cyclohexyl
	142.	OCF ₃	H	H	Cyclohexyl
	143.	OCHF ₂	H	H	Cyclohexyl
45	144.	H	Cl	H	H
	145.	H	Br	H	H
	146.	H	F	H	H
	147.	H	CH ₃	H	H
	148.	H	C ₂ H ₅	H	H
	149.	H	CH(CH ₃) ₂	H	H

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	150.	H	OCH ₃	H	H
	151.	H	CN	H	H
	152.	H	CF ₃	H	H
5	153.	H	OCF ₃	H	H
	154.	H	OCHF ₂	H	H
	155.	H	Cl	H	CH ₃
	156.	H	Br	H	CH ₃
	157.	H	F	H	CH ₃
	158.	H	CH ₃	H	CH ₃
10	159.	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃
	160.	H	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃
	161.	H	OCH ₃	H	CH ₃
	162.	H	CN	H	CH ₃
	163.	H	CF ₃	H	CH ₃
15	164.	H	OCF ₃	H	CH ₃
	165.	H	OCHF ₂	H	CH ₃
	166.	H	Cl	H	C ₂ H ₅
	167.	H	Br	H	C ₂ H ₅
	168.	H	F	H	C ₂ H ₅
	169.	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅
20	170.	H	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
	171.	H	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅
	172.	H	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	173.	H	CN	H	C ₂ H ₅
	174.	H	CF ₃	H	C ₂ H ₅
25	175.	H	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
	176.	H	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅
	177.	H	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	178.	H	Br	H	n-C ₃ H ₇
	179.	H	F	H	n-C ₃ H ₇
	180.	H	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
30	181.	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇
	182.	H	CH(CH ₃) ₂	H	n-C ₃ H ₇
	183.	H	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	184.	H	CN	H	n-C ₃ H ₇
	185.	H	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
35	186.	H	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	187.	H	OCHF ₂	H	n-C ₃ H ₇
	188.	H	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
	189.	H	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	190.	H	F	H	CH(CH ₃) ₂
	191.	H	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
40	192.	H	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
	193.	H	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂
	194.	H	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	195.	H	CN	H	CH(CH ₃) ₂
	196.	H	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
45	197.	H	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	198.	H	OCHF ₂	H	CH(CH ₃) ₂
	199.	H	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	200.	H	Br	H	n-C ₄ H ₉

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
201.	H	F	H	n-C ₄ H ₉
202.	H	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
203.	H	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉
204.	H	CH(CH ₃) ₂	H	n-C ₄ H ₉
205.	H	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
206.	H	CN	H	n-C ₄ H ₉
207.	H	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
208.	H	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
209.	H	OCHF ₂	H	n-C ₄ H ₉
210.	H	Cl	H	C(CH ₃) ₃
211.	H	Br	H	C(CH ₃) ₃
212.	H	F	H	C(CH ₃) ₃
213.	H	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
214.	H	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
215.	H	CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃
216.	H	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
217.	H	CN	H	C(CH ₃) ₃
218.	H	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
219.	H	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
220.	H	OCHF ₂	H	C(CH ₃) ₃
221.	H	Cl	H	C ₆ H ₅
222.	H	Br	H	C ₆ H ₅
223.	H	F	H	C ₆ H ₅
224.	H	CH ₃	H	C ₆ H ₅
225.	H	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
226.	H	CH(CH ₃) ₂	H	C ₆ H ₅
227.	H	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
228.	H	CN	H	C ₆ H ₅
229.	H	CF ₃	H	C ₆ H ₅
230.	H	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
231.	H	OCHF ₂	H	C ₆ H ₅
232.	H	Cl	H	Cyclopropyl
233.	H	Br	H	Cyclopropyl
234.	H	F	H	Cyclopropyl
235.	H	CH ₃	H	Cyclopropyl
236.	H	C ₂ H ₅	H	Cyclopropyl
237.	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cyclopropyl
238.	H	OCH ₃	H	Cyclopropyl
239.	H	CN	H	Cyclopropyl
240.	H	CF ₃	H	Cyclopropyl
241.	H	OCF ₃	H	Cyclopropyl
242.	H	OCHF ₂	H	Cyclopropyl
243.	H	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
244.	H	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
245.	H	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
246.	H	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
247.	H	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -Cyclopropyl
248.	H	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -Cyclopropyl
249.	H	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
250.	H	CN	H	CH ₂ -Cyclopropyl
251.	H	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl

25

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	252.	H	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	253.	H	OCHF ₂	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	254.	H	Cl	H	Cyclobutyl
5	255.	H	Br	H	Cyclobutyl
	256.	H	F	H	Cyclobutyl
	257.	H	CH ₃	H	Cyclobutyl
	258.	H	C ₂ H ₅	H	Cyclobutyl
	259.	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cyclobutyl
10	260.	H	OCH ₃	H	Cyclobutyl
	261.	H	CN	H	Cyclobutyl
	262.	H	CF ₃	H	Cyclobutyl
	263.	H	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	264.	H	OCHF ₂	H	Cyclobutyl
	265.	H	Cl	H	Cyclopentyl
15	266.	H	Br	H	Cyclopentyl
	267.	H	F	H	Cyclopentyl
	268.	H	CH ₃	H	Cyclopentyl
	269.	H	C ₂ H ₅	H	Cyclopentyl
	270.	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cyclopentyl
	271.	H	OCH ₃	H	Cyclopentyl
20	272.	H	CN	H	Cyclopentyl
	273.	H	CF ₃	H	Cyclopentyl
	274.	H	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	275.	H	OCHF ₂	H	Cyclopentyl
	276.	H	Cl	H	Cyclohexyl
25	277.	H	Br	H	Cyclohexyl
	278.	H	F	H	Cyclohexyl
	279.	H	CH ₃	H	Cyclohexyl
	280.	H	C ₂ H ₅	H	Cyclohexyl
	281.	H	CH(CH ₃) ₂	H	Cyclohexyl
	282.	H	OCH ₃	H	Cyclohexyl
30	283.	H	CN	H	Cyclohexyl
	284.	H	CF ₃	H	Cyclohexyl
	285.	H	OCF ₃	H	Cyclohexyl
	286.	H	OCHF ₂	H	Cyclohexyl
	287.	CF ₃	Br	H	H
35	288.	CF ₃	OCH ₃	H	H
	289.	CF ₃	Cl	H	H
	290.	CF ₃	F	H	H
	291.	CF ₃	CH ₃	H	H
	292.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	H
	293.	CF ₃	CF ₃	H	H
40	294.	CF ₃	OCF ₃	H	H
	295.	CF ₃	OCHF ₂	H	H
	296.	CF ₃	Br	H	CH ₃
	297.	CF ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	298.	CF ₃	Cl	H	CH ₃
	299.	CF ₃	F	H	CH ₃
45	300.	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
	301.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
	302.	CF ₃	CF ₃	H	CH ₃

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
303.	CF ₃	OCF ₃	H	CH ₃
304.	CF ₃	OCHF ₂	H	CH ₃
305.	CF ₃	Br	H	C ₂ H ₅
306.	CF ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
307.	CF ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
308.	CF ₃	F	H	C ₂ H ₅
309.	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
310.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
311.	CF ₃	CF ₃	H	C ₂ H ₅
312.	CF ₃	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
313.	CF ₃	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅
314.	CF ₃	Br	H	n-C ₃ H ₇
315.	CF ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
316.	CF ₃	Cl	H	n-C ₃ H ₇
317.	CF ₃	F	H	n-C ₃ H ₇
318.	CF ₃	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
319.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇
320.	CF ₃	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
321.	CF ₃	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
322.	CF ₃	OCHF ₂	H	n-C ₃ H ₇
323.	CF ₃	Br	H	CH(CH ₃) ₂
324.	CF ₃	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
325.	CF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
326.	CF ₃	F	H	CH(CH ₃) ₂
327.	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
328.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
329.	CF ₃	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
330.	CF ₃	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
331.	CF ₃	OCHF ₂	H	CH(CH ₃) ₂
332.	CF ₃	Br	H	n-C ₄ H ₉
333.	CF ₃	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
334.	CF ₃	Cl	H	n-C ₄ H ₉
335.	CF ₃	F	H	n-C ₄ H ₉
336.	CF ₃	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
337.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉
338.	CF ₃	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
339.	CF ₃	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
340.	CF ₃	OCHF ₂	H	n-C ₄ H ₉
341.	CF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₃
342.	CF ₃	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
343.	CF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₃
344.	CF ₃	F	H	C(CH ₃) ₃
345.	CF ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
346.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
347.	CF ₃	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
348.	CF ₃	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
349.	CF ₃	OCHF ₂	H	C(CH ₃) ₃
350.	CF ₃	Br	H	C ₆ H ₅
351.	CF ₃	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
352.	CF ₃	Cl	H	C ₆ H ₅
353.	CF ₃	F	H	C ₆ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	354.	CF ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅
	355.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
	356.	CF ₃	CF ₃	H	C ₆ H ₅
5	357.	CF ₃	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
	358.	CF ₃	OCHF ₂	H	C ₆ H ₅
	359.	CF ₃	Br	H	Cyclopropyl
	360.	CF ₃	OCH ₃	H	Cyclopropyl
	361.	CF ₃	Cl	H	Cyclopropyl
10	362.	CF ₃	F	H	Cyclopropyl
	363.	CF ₃	CH ₃	H	Cyclopropyl
	364.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopropyl
	365.	CF ₃	CF ₃	H	Cyclopropyl
	366.	CF ₃	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	367.	CF ₃	OCHF ₂	H	Cyclopropyl
15	368.	CF ₃	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	369.	CF ₃	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	370.	CF ₃	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	371.	CF ₃	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	372.	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
20	373.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	374.	CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	375.	CF ₃	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	376.	CF ₃	OCHF ₂	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	377.	CF ₃	Br	H	Cyclobutyl
	378.	CF ₃	OCH ₃	H	Cyclobutyl
25	379.	CF ₃	Cl	H	Cyclobutyl
	380.	CF ₃	F	H	Cyclobutyl
	381.	CF ₃	CH ₃	H	Cyclobutyl
	382.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclobutyl
	383.	CF ₃	CF ₃	H	Cyclobutyl
30	384.	CF ₃	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	385.	CF ₃	OCHF ₂	H	Cyclobutyl
	386.	CF ₃	Br	H	Cyclopentyl
	387.	CF ₃	OCH ₃	H	Cyclopentyl
	388.	CF ₃	Cl	H	Cyclopentyl
	389.	CF ₃	F	H	Cyclopentyl
35	390.	CF ₃	CH ₃	H	Cyclopentyl
	391.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopentyl
	392.	CF ₃	CF ₃	H	Cyclopentyl
	393.	CF ₃	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	394.	CF ₃	OCHF ₂	H	Cyclopentyl
40	395.	CF ₃	Br	H	Cyclohexyl
	396.	CF ₃	OCH ₃	H	Cyclohexyl
	397.	CF ₃	Cl	H	Cyclohexyl
	398.	CF ₃	F	H	Cyclohexyl
	399.	CF ₃	CH ₃	H	Cyclohexyl
	400.	CF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclohexyl
45	401.	CF ₃	CF ₃	H	Cyclohexyl
	402.	CF ₃	OCF ₃	H	Cyclohexyl
	403.	CF ₃	OCHF ₂	H	Cyclohexyl
	404.	CF ₃	H	Br	H

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	405.	CF ₃	H	OCH ₃	H
	406.	CF ₃	H	Cl	H
	407.	CF ₃	H	F	H
	408.	CF ₃	H	CH ₃	H
	409.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	H
10	410.	CF ₃	H	CF ₃	H
	411.	CF ₃	H	OCF ₃	H
	412.	CF ₃	H	OCHF ₂	H
	413.	CF ₃	H	Br	CH ₃
	414.	CF ₃	H	OCH ₃	CH ₃
15	415.	CF ₃	H	Cl	CH ₃
	416.	CF ₃	H	F	CH ₃
	417.	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃
	418.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃
	419.	CF ₃	H	CF ₃	CH ₃
20	420.	CF ₃	H	OCF ₃	CH ₃
	421.	CF ₃	H	OCHF ₂	CH ₃
	422.	CF ₃	H	Br	C ₂ H ₅
	423.	CF ₃	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
	424.	CF ₃	H	Cl	C ₂ H ₅
25	425.	CF ₃	H	F	C ₂ H ₅
	426.	CF ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
	427.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
	428.	CF ₃	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	429.	CF ₃	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
30	430.	CF ₃	H	OCHF ₂	C ₂ H ₅
	431.	CF ₃	H	Br	n-C ₃ H ₇
	432.	CF ₃	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
	433.	CF ₃	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	434.	CF ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
35	435.	CF ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
	436.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
	437.	CF ₃	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
	438.	CF ₃	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
	439.	CF ₃	H	OCHF ₂	n-C ₃ H ₇
40	440.	CF ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	441.	CF ₃	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
	442.	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	443.	CF ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
	444.	CF ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
45	445.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
	446.	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	447.	CF ₃	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
	448.	CF ₃	H	OCHF ₂	CH(CH ₃) ₂
	449.	CF ₃	H	Br	n-C ₄ H ₉
	450.	CF ₃	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	451.	CF ₃	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	452.	CF ₃	H	F	n-C ₄ H ₉
	453.	CF ₃	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	454.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
	455.	CF ₃	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	456.	CF ₃	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	457.	CF ₃	H	OCHF ₂	n-C ₄ H ₉
	458.	CF ₃	H	Br	C(CH ₃) ₃
5	459.	CF ₃	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
	460.	CF ₃	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	461.	CF ₃	H	F	C(CH ₃) ₃
	462.	CF ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	463.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
10	464.	CF ₃	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
	465.	CF ₃	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	466.	CF ₃	H	OCHF ₂	C(CH ₃) ₃
	467.	CF ₃	H	Br	C ₆ H ₅
	468.	CF ₃	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	469.	CF ₃	H	Cl	C ₆ H ₅
15	470.	CF ₃	H	F	C ₆ H ₅
	471.	CF ₃	H	CH ₃	C ₆ H ₅
	472.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
	473.	CF ₃	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	474.	CF ₃	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	475.	CF ₃	H	OCHF ₂	C ₆ H ₅
20	476.	CF ₃	H	Br	Cyclopropyl
	477.	CF ₃	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	478.	CF ₃	H	Cl	Cyclopropyl
	479.	CF ₃	H	F	Cyclopropyl
	480.	CF ₃	H	CH ₃	Cyclopropyl
25	481.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopropyl
	482.	CF ₃	H	CF ₃	Cyclopropyl
	483.	CF ₃	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	484.	CF ₃	H	OCHF ₂	Cyclopropyl
	485.	CF ₃	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	486.	CF ₃	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
30	487.	CF ₃	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	488.	CF ₃	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	489.	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	490.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ -Cyclopropyl
	491.	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
35	492.	CF ₃	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	493.	CF ₃	H	OCHF ₂	CH ₂ -Cyclopropyl
	494.	CF ₃	H	Br	Cyclobutyl
	495.	CF ₃	H	OCH ₃	Cyclobutyl
	496.	CF ₃	H	Cl	Cyclobutyl
	497.	CF ₃	H	F	Cyclobutyl
40	498.	CF ₃	H	CH ₃	Cyclobutyl
	499.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclobutyl
	500.	CF ₃	H	CF ₃	Cyclobutyl
	501.	CF ₃	H	OCF ₃	Cyclobutyl
	502.	CF ₃	H	OCHF ₂	Cyclobutyl
45	503.	CF ₃	H	Br	Cyclopentyl
	504.	CF ₃	H	OCH ₃	Cyclopentyl
	505.	CF ₃	H	Cl	Cyclopentyl
	506.	CF ₃	H	F	Cyclopentyl

30

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
507.	CF ₃	H	CH ₃	Cyclopentyl
508.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopentyl
509.	CF ₃	H	CF ₃	Cyclopentyl
510.	CF ₃	H	OCF ₃	Cyclopentyl
511.	CF ₃	H	OCHF ₂	Cyclopentyl
512.	CF ₃	H	Br	Cyclohexyl
513.	CF ₃	H	OCH ₃	Cyclohexyl
514.	CF ₃	H	Cl	Cyclohexyl
515.	CF ₃	H	F	Cyclohexyl
516.	CF ₃	H	CH ₃	Cyclohexyl
517.	CF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclohexyl
518.	CF ₃	H	CF ₃	Cyclohexyl
519.	CF ₃	H	OCF ₃	Cyclohexyl
520.	CF ₃	H	OCHF ₂	Cyclohexyl
521.	OCF ₃	Br	H	H
522.	OCF ₃	OCH ₃	H	H
523.	OCF ₃	Cl	H	H
524.	OCF ₃	F	H	H
525.	OCF ₃	CH ₃	H	H
526.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	H
527.	OCF ₃	CF ₃	H	H
528.	OCF ₃	OCF ₃	H	H
529.	OCF ₃	OCHF ₂	H	H
530.	OCF ₃	Br	H	CH ₃
531.	OCF ₃	OCH ₃	H	CH ₃
532.	OCF ₃	Cl	H	CH ₃
533.	OCF ₃	F	H	CH ₃
534.	OCF ₃	CH ₃	H	CH ₃
535.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
536.	OCF ₃	CF ₃	H	CH ₃
537.	OCF ₃	OCF ₃	H	CH ₃
538.	OCF ₃	OCHF ₂	H	CH ₃
539.	OCF ₃	Br	H	C ₂ H ₅

35

40

45

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	540.	OCF ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	541.	OCF ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
5	542.	OCF ₃	F	H	C ₂ H ₅
	543.	OCF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	544.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
	545.	OCF ₃	CF ₃	H	C ₂ H ₅
	546.	OCF ₃	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
	547.	OCF ₃	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅
10	548.	OCF ₃	Br	H	n-C ₃ H ₇
	549.	OCF ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	550.	OCF ₃	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	551.	OCF ₃	F	H	n-C ₃ H ₇
	552.	OCF ₃	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
15	553.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇
	554.	OCF ₃	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	555.	OCF ₃	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	556.	OCF ₃	OCHF ₂	H	n-C ₃ H ₇
	557.	OCF ₃	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	558.	OCF ₃	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
20	559.	OCF ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
	560.	OCF ₃	F	H	CH(CH ₃) ₂
	561.	OCF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	562.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
	563.	OCF ₃	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
25	564.	OCF ₃	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	565.	OCF ₃	OCHF ₂	H	CH(CH ₃) ₂
	566.	OCF ₃	Br	H	n-C ₄ H ₉
	567.	OCF ₃	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	568.	OCF ₃	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	569.	OCF ₃	F	H	n-C ₄ H ₉
30	570.	OCF ₃	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	571.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉
	572.	OCF ₃	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	573.	OCF ₃	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	574.	OCF ₃	OCHF ₂	H	n-C ₄ H ₉
35	575.	OCF ₃	Br	H	C(CH ₃) ₃
	576.	OCF ₃	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	577.	OCF ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	578.	OCF ₃	F	H	C(CH ₃) ₃
	579.	OCF ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	580.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
40	581.	OCF ₃	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	582.	OCF ₃	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	583.	OCF ₃	OCHF ₂	H	C(CH ₃) ₃
	584.	OCF ₃	Br	H	C ₆ H ₅
	585.	OCF ₃	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
45	586.	OCF ₃	Cl	H	C ₆ H ₅
	587.	OCF ₃	F	H	C ₆ H ₅
	588.	OCF ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	589.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
	590.	OCF ₃	CF ₃	H	C ₆ H ₅
	591.	OCF ₃	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
5	592.	OCF ₃	OCHF ₂	H	C ₆ H ₅
	593.	OCF ₃	Br	H	Cyclopropyl
	594.	OCF ₃	OCH ₃	H	Cyclopropyl
	595.	OCF ₃	Cl	H	Cyclopropyl
	596.	OCF ₃	F	H	Cyclopropyl
	597.	OCF ₃	CH ₃	H	Cyclopropyl
10	598.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopropyl
	599.	OCF ₃	CF ₃	H	Cyclopropyl
	600.	OCF ₃	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	601.	OCF ₃	OCHF ₂	H	Cyclopropyl
	602.	OCF ₃	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
15	603.	OCF ₃	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	604.	OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	605.	OCF ₃	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	606.	OCF ₃	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	607.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	608.	OCF ₃	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
20	609.	OCF ₃	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	610.	OCF ₃	OCHF ₂	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	611.	OCF ₃	Br	H	Cyclobutyl
	612.	OCF ₃	OCH ₃	H	Cyclobutyl
	613.	OCF ₃	Cl	H	Cyclobutyl
25	614.	OCF ₃	F	H	Cyclobutyl
	615.	OCF ₃	CH ₃	H	Cyclobutyl
	616.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclobutyl
	617.	OCF ₃	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	618.	OCF ₃	CF ₃	H	Cyclobutyl
	619.	OCF ₃	OCHF ₂	H	Cyclobutyl
30	620.	OCF ₃	Br	H	Cyclopentyl
	621.	OCF ₃	OCH ₃	H	Cyclopentyl
	622.	OCF ₃	Cl	H	Cyclopentyl
	623.	OCF ₃	F	H	Cyclopentyl
	624.	OCF ₃	CH ₃	H	Cyclopentyl
35	625.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopentyl
	626.	OCF ₃	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	627.	OCF ₃	CF ₃	H	Cyclopentyl
	628.	OCF ₃	OCHF ₂	H	Cyclopentyl
	629.	OCF ₃	Br	H	Cyclohexyl
	630.	OCF ₃	OCH ₃	H	Cyclohexyl
40	631.	OCF ₃	Cl	H	Cyclohexyl
	632.	OCF ₃	F	H	Cyclohexyl
	633.	OCF ₃	CH ₃	H	Cyclohexyl
	634.	OCF ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclohexyl
	635.	OCF ₃	OCF ₃	H	Cyclohexyl
45	636.	OCF ₃	CF ₃	H	Cyclohexyl
	637.	OCF ₃	OCHF ₂	H	Cyclohexyl
	638.	OCF ₃	H	Br	H
	639.	OCF ₃	H	OCH ₃	H

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	640.	OCF ₃	H	Cl	H
	641.	OCF ₃	H	F	H
	642.	OCF ₃	H	CH ₃	H
5	643.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	H
	644.	OCF ₃	H	CF ₃	H
	645.	OCF ₃	H	OCF ₃	H
	646.	OCF ₃	H	OCHF ₂	H
	647.	OCF ₃	H	Br	CH ₃
	648.	OCF ₃	H	OCH ₃	CH ₃
10	649.	OCF ₃	H	Cl	CH ₃
	650.	OCF ₃	H	F	CH ₃
	651.	OCF ₃	H	CH ₃	CH ₃
	652.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃
	653.	OCF ₃	H	CF ₃	CH ₃
15	654.	OCF ₃	H	OCF ₃	CH ₃
	655.	OCF ₃	H	OCHF ₂	CH ₃
	656.	OCF ₃	H	Br	C ₂ H ₅
	657.	OCF ₃	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
	658.	OCF ₃	H	Cl	C ₂ H ₅
	659.	OCF ₃	H	F	C ₂ H ₅
20	660.	OCF ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
	661.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
	662.	OCF ₃	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	663.	OCF ₃	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
	664.	OCF ₃	H	OCHF ₂	C ₂ H ₅
25	665.	OCF ₃	H	Br	n-C ₃ H ₇
	666.	OCF ₃	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
	667.	OCF ₃	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	668.	OCF ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
	669.	OCF ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
	670.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
30	671.	OCF ₃	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
	672.	OCF ₃	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
	673.	OCF ₃	H	OCHF ₂	n-C ₃ H ₇
	674.	OCF ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	675.	OCF ₃	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
35	676.	OCF ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	677.	OCF ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
	678.	OCF ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	679.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
	680.	OCF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	681.	OCF ₃	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
40	682.	OCF ₃	H	OCHF ₂	CH(CH ₃) ₂
	683.	OCF ₃	H	Br	n-C ₄ H ₉
	684.	OCF ₃	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	685.	OCF ₃	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	686.	OCF ₃	H	F	n-C ₄ H ₉
45	687.	OCF ₃	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	688.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
	689.	OCF ₃	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
	690.	OCF ₃	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	691.	OCF ₃	H	OCHF ₂	n-C ₄ H ₉
	692.	OCF ₃	H	Br	C(CH ₃) ₃
	693.	OCF ₃	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
5	694.	OCF ₃	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	695.	OCF ₃	H	F	C(CH ₃) ₃
	696.	OCF ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	697.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
	698.	OCF ₃	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
10	699.	OCF ₃	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	700.	OCF ₃	H	OCHF ₂	C(CH ₃) ₃
	701.	OCF ₃	H	Br	C ₆ H ₅
	702.	OCF ₃	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	703.	OCF ₃	H	Cl	C ₆ H ₅
	704.	OCF ₃	H	F	C ₆ H ₅
15	705.	OCF ₃	H	CH ₃	C ₆ H ₅
	706.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
	707.	OCF ₃	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	708.	OCF ₃	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	709.	OCF ₃	H	OCHF ₂	C ₆ H ₅
20	710.	OCF ₃	H	Br	Cyclopropyl
	711.	OCF ₃	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	712.	OCF ₃	H	Cl	Cyclopropyl
	713.	OCF ₃	H	F	Cyclopropyl
	714.	OCF ₃	H	CH ₃	Cyclopropyl
	715.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopropyl
25	716.	OCF ₃	H	CF ₃	Cyclopropyl
	717.	OCF ₃	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	718.	OCF ₃	H	OCHF ₂	Cyclopropyl
	719.	OCF ₃	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	720.	OCF ₃	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	721.	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
30	722.	OCF ₃	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	723.	OCF ₃	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	724.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ -Cyclopropyl
	725.	OCF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	726.	OCF ₃	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
35	727.	OCF ₃	H	OCHF ₂	CH ₂ -Cyclopropyl
	728.	OCF ₃	H	Br	Cyclobutyl
	729.	OCF ₃	H	OCH ₃	Cyclobutyl
	730.	OCF ₃	H	Cl	Cyclobutyl
	731.	OCF ₃	H	F	Cyclobutyl
	732.	OCF ₃	H	CH ₃	Cyclobutyl
40	733.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclobutyl
	734.	OCF ₃	H	CF ₃	Cyclobutyl
	735.	OCF ₃	H	OCF ₃	Cyclobutyl
	736.	OCF ₃	H	OCHF ₂	Cyclobutyl
	737.	OCF ₃	H	Br	Cyclopentyl
45	738.	OCF ₃	H	OCH ₃	Cyclopentyl
	739.	OCF ₃	H	Cl	Cyclopentyl
	740.	OCF ₃	H	F	Cyclopentyl
	741.	OCF ₃	H	CH ₃	Cyclopentyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	742.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopentyl
	743.	OCF ₃	H	CF ₃	Cyclopentyl
	744.	OCF ₃	H	OCF ₃	Cyclopentyl
5	745.	OCF ₃	H	OCHF ₂	Cyclopentyl
	746.	OCF ₃	H	Br	Cyclohexyl
	747.	OCF ₃	H	OCH ₃	Cyclohexyl
	748.	OCF ₃	H	Cl	Cyclohexyl
	749.	OCF ₃	H	F	Cyclohexyl
	750.	OCF ₃	H	CH ₃	Cyclohexyl
10	751.	OCF ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclohexyl
	752.	OCF ₃	H	CF ₃	Cyclohexyl
	753.	OCF ₃	H	OCF ₃	Cyclohexyl
	754.	OCF ₃	H	OCHF ₂	Cyclohexyl
	755.	OCHF ₂	Br	H	H
15	756.	OCHF ₂	OCH ₃	H	H
	757.	OCHF ₂	Cl	H	H
	758.	OCHF ₂	F	H	H
	759.	OCHF ₂	CH ₃	H	H
	760.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	H
	761.	OCHF ₂	OCF ₃	H	H
20	762.	OCHF ₂	CF ₃	H	H
	763.	OCHF ₂	Br	H	CH ₃
	764.	OCHF ₂	OCH ₃	H	CH ₃
	765.	OCHF ₂	Cl	H	CH ₃
	766.	OCHF ₂	F	H	CH ₃
25	767.	OCHF ₂	CH ₃	H	CH ₃
	768.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃
	769.	OCHF ₂	OCF ₃	H	CH ₃
	770.	OCHF ₂	CF ₃	H	CH ₃
	771.	OCHF ₂	Br	H	C ₂ H ₅
	772.	OCHF ₂	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
30	773.	OCHF ₂	Cl	H	C ₂ H ₅
	774.	OCHF ₂	F	H	C ₂ H ₅
	775.	OCHF ₂	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	776.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
	777.	OCHF ₂	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
35	778.	OCHF ₂	CF ₃	H	C ₂ H ₅
	779.	OCHF ₂	Br	H	n-C ₃ H ₇
	780.	OCHF ₂	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	781.	OCHF ₂	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	782.	OCHF ₂	F	H	n-C ₃ H ₇
	783.	OCHF ₂	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
40	784.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇
	785.	OCHF ₂	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	786.	OCHF ₂	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	787.	OCHF ₂	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	788.	OCHF ₂	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	789.	OCHF ₂	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
45	790.	OCHF ₂	F	H	CH(CH ₃) ₂
	791.	OCHF ₂	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	792.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	793.	OCHF ₂	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	794.	OCHF ₂	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	795.	OCHF ₂	Br	H	n-C ₄ H ₉
5	796.	OCHF ₂	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	797.	OCHF ₂	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	798.	OCHF ₂	F	H	n-C ₄ H ₉
	799.	OCHF ₂	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	800.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉
10	801.	OCHF ₂	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	802.	OCHF ₂	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	803.	OCHF ₂	Br	H	C(CH ₃) ₃
	804.	OCHF ₂	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	805.	OCHF ₂	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	806.	OCHF ₂	F	H	C(CH ₃) ₃
15	807.	OCHF ₂	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	808.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
	809.	OCHF ₂	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	810.	OCHF ₂	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	811.	OCHF ₂	Br	H	C ₆ H ₅
	812.	OCHF ₂	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
20	813.	OCHF ₂	Cl	H	C ₆ H ₅
	814.	OCHF ₂	F	H	C ₆ H ₅
	815.	OCHF ₂	CH ₃	H	C ₆ H ₅
	816.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
	817.	OCHF ₂	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
25	818.	OCHF ₂	CF ₃	H	C ₆ H ₅
	819.	OCHF ₂	Br	H	Cyclopropyl
	820.	OCHF ₂	OCH ₃	H	Cyclopropyl
	821.	OCHF ₂	Cl	H	Cyclopropyl
	822.	OCHF ₂	F	H	Cyclopropyl
	823.	OCHF ₂	CH ₃	H	Cyclopropyl
30	824.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	Cyclopropyl
	825.	OCHF ₂	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	826.	OCHF ₂	CF ₃	H	Cyclopropyl
	827.	OCHF ₂	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	828.	OCHF ₂	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
35	829.	OCHF ₂	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	830.	OCHF ₂	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	831.	OCHF ₂	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	832.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	833.	OCHF ₂	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	834.	OCHF ₂	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
40	835.	OCHF ₂	Br	H	Cyclobutyl
	836.	OCHF ₂	OCH ₃	H	Cyclobutyl
	837.	OCHF ₂	Cl	H	Cyclobutyl
	838.	OCHF ₂	F	H	Cyclobutyl
	839.	OCHF ₂	CH ₃	H	Cyclobutyl
45	840.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	Cyclobutyl
	841.	OCHF ₂	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	842.	OCHF ₂	CF ₃	H	Cyclobutyl
	843.	OCHF ₂	Br	H	Cyclopentyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	844.	OCHF ₂	OCH ₃	H	Cyclopentyl
	845.	OCHF ₂	Cl	H	Cyclopentyl
	846.	OCHF ₂	F	H	Cyclopentyl
5	847.	OCHF ₂	CH ₃	H	Cyclopentyl
	848.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	Cyclopentyl
	849.	OCHF ₂	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	850.	OCHF ₂	CF ₃	H	Cyclopentyl
	851.	OCHF ₂	Br	H	Cyclohexyl
	852.	OCHF ₂	OCH ₃	H	Cyclohexyl
10	853.	OCHF ₂	Cl	H	Cyclohexyl
	854.	OCHF ₂	F	H	Cyclohexyl
	855.	OCHF ₂	CH ₃	H	Cyclohexyl
	856.	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H	Cyclohexyl
	857.	OCHF ₂	OCF ₃	H	Cyclohexyl
15	858.	OCHF ₂	CF ₃	H	Cyclohexyl
	859.	OCHF ₂	H	Br	H
	860.	OCHF ₂	H	OCH ₃	H
	861.	OCHF ₂	H	Cl	H
	862.	OCHF ₂	H	F	H
	863.	OCHF ₂	H	CH ₃	H
20	864.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	H
	865.	OCHF ₂	H	OCF ₃	H
	866.	OCHF ₂	H	CF ₃	H
	867.	OCHF ₂	H	Br	CH ₃
	868.	OCHF ₂	H	OCH ₃	CH ₃
25	869.	OCHF ₂	H	Cl	CH ₃
	870.	OCHF ₂	H	F	CH ₃
	871.	OCHF ₂	H	CH ₃	CH ₃
	872.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃
	873.	OCHF ₂	H	OCF ₃	CH ₃
	874.	OCHF ₂	H	CF ₃	CH ₃
30	875.	OCHF ₂	H	Br	C ₂ H ₅
	876.	OCHF ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
	877.	OCHF ₂	H	Cl	C ₂ H ₅
	878.	OCHF ₂	H	F	C ₂ H ₅
	879.	OCHF ₂	H	CH ₃	C ₂ H ₅
35	880.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
	881.	OCHF ₂	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
	882.	OCHF ₂	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	883.	OCHF ₂	H	Br	n-C ₃ H ₇
	884.	OCHF ₂	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
	885.	OCHF ₂	H	Cl	n-C ₃ H ₇
40	886.	OCHF ₂	H	F	n-C ₃ H ₇
	887.	OCHF ₂	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
	888.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
	889.	OCHF ₂	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
	890.	OCHF ₂	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
45	891.	OCHF ₂	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	892.	OCHF ₂	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
	893.	OCHF ₂	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	894.	OCHF ₂	H	F	CH(CH ₃) ₂

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	895.	OCHF ₂	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	896.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
	897.	OCHF ₂	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
5	898.	OCHF ₂	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	899.	OCHF ₂	H	Br	n-C ₄ H ₉
	900.	OCHF ₂	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	901.	OCHF ₂	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	902.	OCHF ₂	H	F	n-C ₄ H ₉
10	903.	OCHF ₂	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	904.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
	905.	OCHF ₂	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	906.	OCHF ₂	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
	907.	OCHF ₂	H	Br	C(CH ₃) ₃
	908.	OCHF ₂	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
15	909.	OCHF ₂	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	910.	OCHF ₂	H	F	C(CH ₃) ₃
	911.	OCHF ₂	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	912.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
	913.	OCHF ₂	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	914.	OCHF ₂	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
20	915.	OCHF ₂	H	Br	C ₆ H ₅
	916.	OCHF ₂	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	917.	OCHF ₂	H	Cl	C ₆ H ₅
	918.	OCHF ₂	H	F	C ₆ H ₅
	919.	OCHF ₂	H	CH ₃	C ₆ H ₅
25	920.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
	921.	OCHF ₂	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	922.	OCHF ₂	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	923.	OCHF ₂	H	Br	Cyclopropyl
	924.	OCHF ₂	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	925.	OCHF ₂	H	Cl	Cyclopropyl
30	926.	OCHF ₂	H	F	Cyclopropyl
	927.	OCHF ₂	H	CH ₃	Cyclopropyl
	928.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	Cyclopropyl
	929.	OCHF ₂	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	930.	OCHF ₂	H	CF ₃	Cyclopropyl
35	931.	OCHF ₂	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	932.	OCHF ₂	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	933.	OCHF ₂	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	934.	OCHF ₂	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	935.	OCHF ₂	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	936.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ -Cyclopropyl
40	937.	OCHF ₂	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	938.	OCHF ₂	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	939.	OCHF ₂	H	Br	Cyclobutyl
	940.	OCHF ₂	H	OCH ₃	Cyclobutyl
	941.	OCHF ₂	H	Cl	Cyclobutyl
45	942.	OCHF ₂	H	F	Cyclobutyl
	943.	OCHF ₂	H	CH ₃	Cyclobutyl
	944.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	Cyclobutyl
	945.	OCHF ₂	H	OCF ₃	Cyclobutyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	946.	OCHF ₂	H	CF ₃	Cyclobutyl
	947.	OCHF ₂	H	Br	Cyclopentyl
	948.	OCHF ₂	H	OCH ₃	Cyclopentyl
	949.	OCHF ₂	H	Cl	Cyclopentyl
	950.	OCHF ₂	H	F	Cyclopentyl
10	951.	OCHF ₂	H	CH ₃	Cyclopentyl
	952.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	Cyclopentyl
	953.	OCHF ₂	H	OCF ₃	Cyclopentyl
	954.	OCHF ₂	H	CF ₃	Cyclopentyl
	955.	OCHF ₂	H	Br	Cyclohexyl
15	956.	OCHF ₂	H	OCH ₃	Cyclohexyl
	957.	OCHF ₂	H	Cl	Cyclohexyl
	958.	OCHF ₂	H	F	Cyclohexyl
	959.	OCHF ₂	H	CH ₃	Cyclohexyl
	960.	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅	Cyclohexyl
20	961.	OCHF ₂	H	OCF ₃	Cyclohexyl
	962.	OCHF ₂	H	CF ₃	Cyclohexyl
	963.	OCH ₃	Br	H	H
	964.	OCH ₃	OCH ₃	H	H
	965.	OCH ₃	Cl	H	H
25	966.	OCH ₃	F	H	H
	967.	OCH ₃	CH ₃	H	H
	968.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	H
	969.	OCH ₃	CF ₃	H	H
	970.	OCH ₃	OCF ₃	H	H
30	971.	OCH ₃	OCHF ₂	H	H
	972.	OCH ₃	Br	H	CH ₃
	973.	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
	974.	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
	975.	OCH ₃	F	H	CH ₃
35	976.	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	977.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
	978.	OCH ₃	CF ₃	H	CH ₃
	979.	OCH ₃	OCF ₃	H	CH ₃
	980.	OCH ₃	OCHF ₂	H	CH ₃
40	981.	OCH ₃	Br	H	C ₂ H ₅
	982.	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	983.	OCH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	984.	OCH ₃	F	H	C ₂ H ₅
	985.	OCH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
45	986.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
	987.	OCH ₃	CF ₃	H	C ₂ H ₅
	988.	OCH ₃	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
	989.	OCH ₃	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅
	990.	OCH ₃	Br	H	n-C ₃ H ₇
45	991.	OCH ₃	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	992.	OCH ₃	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	993.	OCH ₃	F	H	n-C ₃ H ₇
	994.	OCH ₃	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	995.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₃ H ₇
	996.	OCH ₃	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	997.	OCH ₃	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	998.	OCH ₃	OCHF ₂	H	n-C ₃ H ₇
	999.	OCH ₃	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	1000.	OCH ₃	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1001.	OCH ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
10	1002.	OCH ₃	F	H	CH(CH ₃) ₂
	1003.	OCH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1004.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
	1005.	OCH ₃	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1006.	OCH ₃	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
15	1007.	OCH ₃	OCHF ₂	H	CH(CH ₃) ₂
	1008.	OCH ₃	Br	H	n-C ₄ H ₉
	1009.	OCH ₃	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1010.	OCH ₃	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	1011.	OCH ₃	F	H	n-C ₄ H ₉
20	1012.	OCH ₃	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1013.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉
	1014.	OCH ₃	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1015.	OCH ₃	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1016.	OCH ₃	OCHF ₂	H	n-C ₄ H ₉
25	1017.	OCH ₃	Br	H	C(CH ₃) ₃
	1018.	OCH ₃	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1019.	OCH ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	1020.	OCH ₃	F	H	C(CH ₃) ₃
	1021.	OCH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
30	1022.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
	1023.	OCH ₃	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1024.	OCH ₃	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1025.	OCH ₃	OCHF ₂	H	C(CH ₃) ₃
	1026.	OCH ₃	Br	H	C ₆ H ₅
35	1027.	OCH ₃	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
	1028.	OCH ₃	Cl	H	C ₆ H ₅
	1029.	OCH ₃	F	H	C ₆ H ₅
	1030.	OCH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅
	1031.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
40	1032.	OCH ₃	CF ₃	H	C ₆ H ₅
	1033.	OCH ₃	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
	1034.	OCH ₃	OCHF ₂	H	C ₆ H ₅
	1035.	OCH ₃	Br	H	Cyclopropyl
	1036.	OCH ₃	OCH ₃	H	Cyclopropyl
45	1037.	OCH ₃	Cl	H	Cyclopropyl
	1038.	OCH ₃	F	H	Cyclopropyl
	1039.	OCH ₃	CH ₃	H	Cyclopropyl
	1040.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopropyl
	1041.	OCH ₃	CF ₃	H	Cyclopropyl
	1042.	OCH ₃	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	1043.	OCH ₃	OCHF ₂	H	Cyclopropyl
	1044.	OCH ₃	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1045.	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1046.	OCH ₃	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1047.	OCH ₃	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1048.	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1049.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1050.	OCH ₃	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
5	1051.	OCH ₃	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1052.	OCH ₃	OCHF ₂	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1053.	OCH ₃	Br	H	Cyclobutyl
	1054.	OCH ₃	OCH ₃	H	Cyclobutyl
	1055.	OCH ₃	Cl	H	Cyclobutyl
	1056.	OCH ₃	F	H	Cyclobutyl
10	1057.	OCH ₃	CH ₃	H	Cyclobutyl
	1058.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclobutyl
	1059.	OCH ₃	CF ₃	H	Cyclobutyl
	1060.	OCH ₃	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	1061.	OCH ₃	OCHF ₂	H	Cyclobutyl
15	1062.	OCH ₃	Br	H	Cyclopentyl
	1063.	OCH ₃	OCH ₃	H	Cyclopentyl
	1064.	OCH ₃	Cl	H	Cyclopentyl
	1065.	OCH ₃	F	H	Cyclopentyl
	1066.	OCH ₃	CH ₃	H	Cyclopentyl
	1067.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclopentyl
20	1068.	OCH ₃	CF ₃	H	Cyclopentyl
	1069.	OCH ₃	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	1070.	OCH ₃	OCHF ₂	H	Cyclopentyl
	1071.	OCH ₃	Br	H	Cyclohexyl
	1072.	OCH ₃	OCH ₃	H	Cyclohexyl
	1073.	OCH ₃	Cl	H	Cyclohexyl
25	1074.	OCH ₃	F	H	Cyclohexyl
	1075.	OCH ₃	CH ₃	H	Cyclohexyl
	1076.	OCH ₃	C ₂ H ₅	H	Cyclohexyl
	1077.	OCH ₃	CF ₃	H	Cyclohexyl
	1078.	OCH ₃	OCF ₃	H	Cyclohexyl
30	1079.	OCH ₃	OCHF ₂	H	Cyclohexyl
	1080.	OCH ₃	H	Br	H
	1081.	OCH ₃	H	OCH ₃	H
	1082.	OCH ₃	H	Cl	H
	1083.	OCH ₃	H	F	H
35	1084.	OCH ₃	H	CH ₃	H
	1085.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	H
	1086.	OCH ₃	H	CF ₃	H
	1087.	OCH ₃	H	OCF ₃	H
	1088.	OCH ₃	H	OCHF ₂	H
	1089.	OCH ₃	H	Br	CH ₃
40	1090.	OCH ₃	H	OCH ₃	CH ₃
	1091.	OCH ₃	H	Cl	CH ₃
	1092.	OCH ₃	H	F	CH ₃
	1093.	OCH ₃	H	CH ₃	CH ₃
	1094.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃
45	1095.	OCH ₃	H	CF ₃	CH ₃
	1096.	OCH ₃	H	OCF ₃	CH ₃
	1097.	OCH ₃	H	OCHF ₂	CH ₃
	1098.	OCH ₃	H	Br	C ₂ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	1099.	OCH ₃	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
	1100.	OCH ₃	H	Cl	C ₂ H ₅
	1101.	OCH ₃	H	F	C ₂ H ₅
	1102.	OCH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
	1103.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
10	1104.	OCH ₃	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	1105.	OCH ₃	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
	1106.	OCH ₃	H	OCHF ₂	C ₂ H ₅
	1107.	OCH ₃	H	Br	n-C ₃ H ₇
	1108.	OCH ₃	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
15	1109.	OCH ₃	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	1110.	OCH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
	1111.	OCH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
	1112.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
	1113.	OCH ₃	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
20	1114.	OCH ₃	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
	1115.	OCH ₃	H	OCHF ₂	n-C ₃ H ₇
	1116.	OCH ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	1117.	OCH ₃	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
	1118.	OCH ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
25	1119.	OCH ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
	1120.	OCH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	1121.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
	1122.	OCH ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	1123.	OCH ₃	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
30	1124.	OCH ₃	H	OCHF ₂	CH(CH ₃) ₂
	1125.	OCH ₃	H	Br	n-C ₄ H ₉
	1126.	OCH ₃	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	1127.	OCH ₃	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	1128.	OCH ₃	H	F	n-C ₄ H ₉
35	1129.	OCH ₃	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	1130.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
	1131.	OCH ₃	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
	1132.	OCH ₃	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	1133.	OCH ₃	H	OCHF ₂	n-C ₄ H ₉
40	1134.	OCH ₃	H	Br	C(CH ₃) ₃
	1135.	OCH ₃	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
	1136.	OCH ₃	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	1137.	OCH ₃	H	F	C(CH ₃) ₃
	1138.	OCH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
45	1139.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
	1140.	OCH ₃	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
	1141.	OCH ₃	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	1142.	OCH ₃	H	OCHF ₂	C(CH ₃) ₃
	1143.	OCH ₃	H	Br	C ₆ H ₅
	1144.	OCH ₃	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	1145.	OCH ₃	H	Cl	C ₆ H ₅
	1146.	OCH ₃	H	F	C ₆ H ₅
	1147.	OCH ₃	H	CH ₃	C ₆ H ₅
	1148.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
	1149.	OCH ₃	H	CF ₃	C ₆ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1150.	OCH ₃	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	1151.	OCH ₃	H	OCHF ₂	C ₆ H ₅
	1152.	OCH ₃	H	Br	Cyclopropyl
5	1153.	OCH ₃	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	1154.	OCH ₃	H	Cl	Cyclopropyl
	1155.	OCH ₃	H	F	Cyclopropyl
	1156.	OCH ₃	H	CH ₃	Cyclopropyl
	1157.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopropyl
	1158.	OCH ₃	H	CF ₃	Cyclopropyl
10	1159.	OCH ₃	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	1160.	OCH ₃	H	OCHF ₂	Cyclopropyl
	1161.	OCH ₃	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	1162.	OCH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1163.	OCH ₃	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
15	1164.	OCH ₃	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	1165.	OCH ₃	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1166.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ -Cyclopropyl
	1167.	OCH ₃	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1168.	OCH ₃	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1169.	OCH ₃	H	OCHF ₂	CH ₂ -Cyclopropyl
20	1170.	OCH ₃	H	Br	Cyclobutyl
	1171.	OCH ₃	H	OCH ₃	Cyclobutyl
	1172.	OCH ₃	H	Cl	Cyclobutyl
	1173.	OCH ₃	H	F	Cyclobutyl
	1174.	OCH ₃	H	CH ₃	Cyclobutyl
25	1175.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclobutyl
	1176.	OCH ₃	H	CF ₃	Cyclobutyl
	1177.	OCH ₃	H	OCF ₃	Cyclobutyl
	1178.	OCH ₃	H	OCHF ₂	Cyclobutyl
	1179.	OCH ₃	H	Br	Cyclopentyl
	1180.	OCH ₃	H	OCH ₃	Cyclopentyl
30	1181.	OCH ₃	H	Cl	Cyclopentyl
	1182.	OCH ₃	H	F	Cyclopentyl
	1183.	OCH ₃	H	CH ₃	Cyclopentyl
	1184.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclopentyl
	1185.	OCH ₃	H	CF ₃	Cyclopentyl
35	1186.	OCH ₃	H	OCF ₃	Cyclopentyl
	1187.	OCH ₃	H	OCHF ₂	Cyclopentyl
	1188.	OCH ₃	H	Br	Cyclohexyl
	1189.	OCH ₃	H	OCH ₃	Cyclohexyl
	1190.	OCH ₃	H	Cl	Cyclohexyl
	1191.	OCH ₃	H	F	Cyclohexyl
40	1192.	OCH ₃	H	CH ₃	Cyclohexyl
	1193.	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	Cyclohexyl
	1194.	OCH ₃	H	CF ₃	Cyclohexyl
	1195.	OCH ₃	H	OCF ₃	Cyclohexyl
	1196.	OCH ₃	H	OCHF ₂	Cyclohexyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	1197.	Cl	Cl	H	H
	1198.	Cl	F	H	H
	1199.	Cl	CH ₃	H	H
	1200.	Cl	OCH ₃	H	H
	1201.	Cl	Br	H	H
10	1202.	Cl	CF ₃	H	H
	1203.	Cl	OCF ₃	H	H
	1204.	Cl	Cl	H	CH ₃
	1205.	Cl	F	H	CH ₃
	1206.	Cl	CH ₃	H	CH ₃
15	1207.	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
	1208.	Cl	Br	H	CH ₃
	1209.	Cl	CF ₃	H	CH ₃
	1210.	Cl	OCF ₃	H	CH ₃
	1211.	Cl	Cl	H	C ₂ H ₅
20	1212.	Cl	F	H	C ₂ H ₅
	1213.	Cl	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	1214.	Cl	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	1215.	Cl	Br	H	C ₂ H ₅
	1216.	Cl	CF ₃	H	C ₂ H ₅
25	1217.	Cl	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
	1218.	Cl	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	1219.	Cl	F	H	n-C ₃ H ₇
	1220.	Cl	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1221.	Cl	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
30	1222.	Cl	Br	H	n-C ₃ H ₇
	1223.	Cl	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1224.	Cl	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1225.	Cl	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
	1226.	Cl	F	H	CH(CH ₃) ₂
35	1227.	Cl	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1228.	Cl	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1229.	Cl	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	1230.	Cl	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1231.	Cl	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
40	1232.	Cl	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	1233.	Cl	F	H	n-C ₄ H ₉
	1234.	Cl	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1235.	Cl	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1236.	Cl	Br	H	n-C ₄ H ₉
45	1237.	Cl	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1238.	Cl	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1239.	Cl	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	1240.	Cl	F	H	C(CH ₃) ₃
	1241.	Cl	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1242.	Cl	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1243.	Cl	Br	H	C(CH ₃) ₃
	1244.	Cl	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1245.	Cl	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1246.	Cl	Cl	H	C ₆ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1247.	Cl	F	H	C ₆ H ₅
	1248.	Cl	CH ₃	H	C ₆ H ₅
	1249.	Cl	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
5	1250.	Cl	Br	H	C ₆ H ₅
	1251.	Cl	CF ₃	H	C ₆ H ₅
	1252.	Cl	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
	1253.	Cl	Cl	H	Cyclopropyl
	1254.	Cl	F	H	Cyclopropyl
	1255.	Cl	CH ₃	H	Cyclopropyl
10	1256.	Cl	OCH ₃	H	Cyclopropyl
	1257.	Cl	Br	H	Cyclopropyl
	1258.	Cl	CF ₃	H	Cyclopropyl
	1259.	Cl	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	1260.	Cl	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
15	1261.	Cl	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1262.	Cl	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1263.	Cl	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1264.	Cl	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1265.	Cl	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1266.	Cl	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
20	1267.	Cl	Cl	H	Cyclobutyl
	1268.	Cl	F	H	Cyclobutyl
	1269.	Cl	CH ₃	H	Cyclobutyl
	1270.	Cl	OCH ₃	H	Cyclobutyl
	1271.	Cl	Br	H	Cyclobutyl
25	1272.	Cl	CF ₃	H	Cyclobutyl
	1273.	Cl	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	1274.	Cl	Cl	H	Cyclopentyl
	1275.	Cl	F	H	Cyclopentyl
	1276.	Cl	CH ₃	H	Cyclopentyl
	1277.	Cl	OCH ₃	H	Cyclopentyl
30	1278.	Cl	Br	H	Cyclopentyl
	1279.	Cl	CF ₃	H	Cyclopentyl
	1280.	Cl	OCF ₃	H	Cyclopentyl
	1281.	Cl	Cl	H	Cyclohexyl
	1282.	Cl	F	H	Cyclohexyl
35	1283.	Cl	CH ₃	H	Cyclohexyl
	1284.	Cl	OCH ₃	H	Cyclohexyl
	1285.	Cl	Br	H	Cyclohexyl
	1286.	Cl	CF ₃	H	Cyclohexyl
	1287.	Cl	OCF ₃	H	Cyclohexyl
	1288.	Cl	H	Cl	H
40	1289.	Cl	H	F	H
	1290.	Cl	H	CH ₃	H
	1291.	Cl	H	OCH ₃	H
	1292.	Cl	H	Br	H
	1293.	Cl	H	CF ₃	H
	1294.	Cl	H	OCF ₃	H
45	1295.	Cl	H	Cl	CH ₃
	1296.	Cl	H	F	CH ₃
	1297.	Cl	H	CH ₃	CH ₃

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
	1298.	Cl	H	OCH ₃	CH ₃
	1299.	Cl	H	Br	CH ₃
	1300.	Cl	H	CF ₃	CH ₃
5	1301.	Cl	H	OCF ₃	CH ₃
	1302.	Cl	H	Cl	C ₂ H ₅
	1303.	Cl	H	F	C ₂ H ₅
	1304.	Cl	H	CH ₃	C ₂ H ₅
	1305.	Cl	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
10	1306.	Cl	H	Br	C ₂ H ₅
	1307.	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	1308.	Cl	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
	1309.	Cl	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	1310.	Cl	H	F	n-C ₃ H ₇
	1311.	Cl	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
15	1312.	Cl	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
	1313.	Cl	H	Br	n-C ₃ H ₇
	1314.	Cl	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
	1315.	Cl	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
	1316.	Cl	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	1317.	Cl	H	F	CH(CH ₃) ₂
20	1318.	Cl	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	1319.	Cl	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
	1320.	Cl	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	1321.	Cl	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	1322.	Cl	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
25	1323.	Cl	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	1324.	Cl	H	F	n-C ₄ H ₉
	1325.	Cl	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	1326.	Cl	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	1327.	Cl	H	Br	n-C ₄ H ₉
	1328.	Cl	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
30	1329.	Cl	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	1330.	Cl	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	1331.	Cl	H	F	C(CH ₃) ₃
	1332.	Cl	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	1333.	Cl	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
35	1334.	Cl	H	Br	C(CH ₃) ₃
	1335.	Cl	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
	1336.	Cl	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	1337.	Cl	H	Cl	C ₆ H ₅
	1338.	Cl	H	F	C ₆ H ₅
	1339.	Cl	H	CH ₃	C ₆ H ₅
40	1340.	Cl	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	1341.	Cl	H	Br	C ₆ H ₅
	1342.	Cl	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	1343.	Cl	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	1344.	Cl	H	Cl	Cyclopropyl
	1345.	Cl	H	F	Cyclopropyl
45	1346.	Cl	H	CH ₃	Cyclopropyl
	1347.	Cl	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	1348.	Cl	H	Br	Cyclopropyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	1349.	Cl	H	CF ₃	Cyclopropyl
	1350.	Cl	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	1351.	Cl	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	1352.	Cl	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	1353.	Cl	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
10	1354.	Cl	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1355.	Cl	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	1356.	Cl	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1357.	Cl	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1358.	Cl	H	Cl	Cyclobutyl
15	1359.	Cl	H	F	Cyclobutyl
	1360.	Cl	H	CH ₃	Cyclobutyl
	1361.	Cl	H	OCH ₃	Cyclobutyl
	1362.	Cl	H	Br	Cyclobutyl
	1363.	Cl	H	CF ₃	Cyclobutyl
20	1364.	Cl	H	OCF ₃	Cyclobutyl
	1365.	Cl	H	Cl	Cyclopentyl
	1366.	Cl	H	F	Cyclopentyl
	1367.	Cl	H	CH ₃	Cyclopentyl
	1368.	Cl	H	OCH ₃	Cyclopentyl
25	1369.	Cl	H	Br	Cyclopentyl
	1370.	Cl	H	CF ₃	Cyclopentyl
	1371.	Cl	H	OCF ₃	Cyclopentyl
	1372.	Cl	H	Cl	Cyclohexyl
	1373.	Cl	H	F	Cyclohexyl
30	1374.	Cl	H	CH ₃	Cyclohexyl
	1375.	Cl	H	OCH ₃	Cyclohexyl
	1376.	Cl	H	Br	Cyclohexyl
	1377.	Cl	H	CF ₃	Cyclohexyl
	1378.	Cl	H	OCF ₃	Cyclohexyl
35	1379.	Br	Cl	H	H
	1380.	Br	F	H	H
	1381.	Br	CH ₃	H	H
	1382.	Br	OCH ₃	H	H
	1383.	Br	Br	H	H
40	1384.	Br	CF ₃	H	H
	1385.	Br	OCF ₃	H	H
	1386.	Br	Cl	H	CH ₃
	1387.	Br	F	H	CH ₃
	1388.	Br	CH ₃	H	CH ₃
45	1389.	Br	OCH ₃	H	CH ₃
	1390.	Br	Br	H	CH ₃
	1391.	Br	CF ₃	H	CH ₃
	1392.	Br	OCF ₃	H	CH ₃
	1393.	Br	Cl	H	C ₂ H ₅
	1394.	Br	F	H	C ₂ H ₅
	1395.	Br	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	1396.	Br	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
	1397.	Br	Br	H	C ₂ H ₅
	1398.	Br	CF ₃	H	C ₂ H ₅
	1399.	Br	OCF ₃	H	C ₂ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1400.	Br	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	1401.	Br	F	H	n-C ₃ H ₇
	1402.	Br	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
5	1403.	Br	OCH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1404.	Br	Br	H	n-C ₃ H ₇
	1405.	Br	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1406.	Br	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1407.	Br	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
	1408.	Br	F	H	CH(CH ₃) ₂
10	1409.	Br	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1410.	Br	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1411.	Br	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	1412.	Br	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1413.	Br	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
15	1414.	Br	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	1415.	Br	F	H	n-C ₄ H ₉
	1416.	Br	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1417.	Br	OCH ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1418.	Br	Br	H	n-C ₄ H ₉
	1419.	Br	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
20	1420.	Br	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1421.	Br	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	1422.	Br	F	H	C(CH ₃) ₃
	1423.	Br	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1424.	Br	OCH ₃	H	C(CH ₃) ₃
25	1425.	Br	Br	H	C(CH ₃) ₃
	1426.	Br	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1427.	Br	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1428.	Br	Cl	H	C ₆ H ₅
	1429.	Br	F	H	C ₆ H ₅
	1430.	Br	CH ₃	H	C ₆ H ₅
30	1431.	Br	OCH ₃	H	C ₆ H ₅
	1432.	Br	Br	H	C ₆ H ₅
	1433.	Br	CF ₃	H	C ₆ H ₅
	1434.	Br	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
	1435.	Br	Cl	H	Cyclopropyl
	1436.	Br	F	H	Cyclopropyl
35	1437.	Br	CH ₃	H	Cyclopropyl
	1438.	Br	OCH ₃	H	Cyclopropyl
	1439.	Br	Br	H	Cyclopropyl
	1440.	Br	CF ₃	H	Cyclopropyl
	1441.	Br	OCF ₃	H	Cyclopropyl
40	1442.	Br	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1443.	Br	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1444.	Br	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1445.	Br	OCH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1446.	Br	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1447.	Br	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
45	1448.	Br	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1449.	Br	Cl	H	Cyclobutyl
	1450.	Br	F	H	Cyclobutyl

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
1451.	Br	CH ₃	H	Cyclobutyl
1452.	Br	OCH ₃	H	Cyclobutyl
1453.	Br	Br	H	Cyclobutyl
5 1454.	Br	CF ₃	H	Cyclobutyl
1455.	Br	OCF ₃	H	Cyclobutyl
1456.	Br	Cl	H	Cyclopentyl
1457.	Br	F	H	Cyclopentyl
1458.	Br	CH ₃	H	Cyclopentyl
1459.	Br	OCH ₃	H	Cyclopentyl
10 1460.	Br	Br	H	Cyclopentyl
1461.	Br	CF ₃	H	Cyclopentyl
1462.	Br	OCF ₃	H	Cyclopentyl
1463.	Br	Cl	H	Cyclohexyl
1464.	Br	F	H	Cyclohexyl
15 1465.	Br	CH ₃	H	Cyclohexyl
1466.	Br	OCH ₃	H	Cyclohexyl
1467.	Br	Br	H	Cyclohexyl
1468.	Br	CF ₃	H	Cyclohexyl
1469.	Br	OCF ₃	H	Cyclohexyl
20 1470.	Br	H	Cl	H
1471.	Br	H	F	H
1472.	Br	H	CH ₃	H
1473.	Br	H	OCH ₃	H
1474.	Br	H	Br	H
1475.	Br	H	CF ₃	H
25 1476.	Br	H	OCF ₃	H
1477.	Br	H	Cl	CH ₃
1478.	Br	H	F	CH ₃
1479.	Br	H	CH ₃	CH ₃
1480.	Br	H	OCH ₃	CH ₃
30 1481.	Br	H	Br	CH ₃
1482.	Br	H	CF ₃	CH ₃
1483.	Br	H	OCF ₃	CH ₃
1484.	Br	H	Cl	C ₂ H ₅
1485.	Br	H	F	C ₂ H ₅
1486.	Br	H	CH ₃	C ₂ H ₅
35 1487.	Br	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
1488.	Br	H	Br	C ₂ H ₅
1489.	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅
1490.	Br	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
1491.	Br	H	Cl	n-C ₃ H ₇
1492.	Br	H	F	n-C ₃ H ₇
40 1493.	Br	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
1494.	Br	H	OCH ₃	n-C ₃ H ₇
1495.	Br	H	Br	n-C ₃ H ₇
1496.	Br	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
1497.	Br	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
45 1498.	Br	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
1499.	Br	H	F	CH(CH ₃) ₂
1500.	Br	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
1501.	Br	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1502.	Br	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	1503.	Br	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
	1504.	Br	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
5	1505.	Br	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	1506.	Br	H	F	n-C ₄ H ₉
	1507.	Br	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	1508.	Br	H	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
	1509.	Br	H	Br	n-C ₄ H ₉
10	1510.	Br	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
	1511.	Br	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	1512.	Br	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	1513.	Br	H	F	C(CH ₃) ₃
	1514.	Br	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	1515.	Br	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
15	1516.	Br	H	Br	C(CH ₃) ₃
	1517.	Br	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
	1518.	Br	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	1519.	Br	H	Cl	C ₆ H ₅
	1520.	Br	H	F	C ₆ H ₅
	1521.	Br	H	CH ₃	C ₆ H ₅
20	1522.	Br	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
	1523.	Br	H	Br	C ₆ H ₅
	1524.	Br	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	1525.	Br	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	1526.	Br	H	Cl	Cyclopropyl
25	1527.	Br	H	F	Cyclopropyl
	1528.	Br	H	CH ₃	Cyclopropyl
	1529.	Br	H	OCH ₃	Cyclopropyl
	1530.	Br	H	Br	Cyclopropyl
	1531.	Br	H	CF ₃	Cyclopropyl
	1532.	Br	H	OCF ₃	Cyclopropyl
30	1533.	Br	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	1534.	Br	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	1535.	Br	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1536.	Br	H	OCH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1537.	Br	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
35	1538.	Br	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1539.	Br	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1540.	Br	H	Cl	Cyclobutyl
	1541.	Br	H	F	Cyclobutyl
	1542.	Br	H	CH ₃	Cyclobutyl
	1543.	Br	H	OCH ₃	Cyclobutyl
40	1544.	Br	H	Br	Cyclobutyl
	1545.	Br	H	CF ₃	Cyclobutyl
	1546.	Br	H	OCF ₃	Cyclobutyl
	1547.	Br	H	Cl	Cyclopentyl
	1548.	Br	H	F	Cyclopentyl
45	1549.	Br	H	CH ₃	Cyclopentyl
	1550.	Br	H	OCH ₃	Cyclopentyl
	1551.	Br	H	Br	Cyclopentyl
	1552.	Br	H	CF ₃	Cyclopentyl

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1553.	Br	H	OCF ₃	Cyclopentyl
	1554.	Br	H	Cl	Cyclohexyl
	1555.	Br	H	F	Cyclohexyl
5	1556.	Br	H	CH ₃	Cyclohexyl
	1557.	Br	H	OCH ₃	Cyclohexyl
	1558.	Br	H	Br	Cyclohexyl
	1559.	Br	H	CF ₃	Cyclohexyl
	1560.	Br	H	OCF ₃	Cyclohexyl
10	1561.	CH ₃	Cl	H	H
	1562.	CH ₃	F	H	H
	1563.	CH ₃	CH ₃	H	H
	1564.	CH ₃	OCH ₃	H	H
	1565.	CH ₃	Br	H	H
	1566.	CH ₃	CF ₃	H	H
15	1567.	CH ₃	OCF ₃	H	H
	1568.	CH ₃	Cl	H	CH ₃
	1569.	CH ₃	F	H	CH ₃
	1570.	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
	1571.	CH ₃	Br	H	CH ₃
	1572.	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃
20	1573.	CH ₃	OCF ₃	H	CH ₃
	1574.	CH ₃	Cl	H	C ₂ H ₅
	1575.	CH ₃	F	H	C ₂ H ₅
	1576.	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
	1577.	CH ₃	Br	H	C ₂ H ₅
25	1578.	CH ₃	CF ₃	H	C ₂ H ₅
	1579.	CH ₃	OCF ₃	H	C ₂ H ₅
	1580.	CH ₃	Cl	H	n-C ₃ H ₇
	1581.	CH ₃	F	H	n-C ₃ H ₇
	1582.	CH ₃	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1583.	CH ₃	Br	H	n-C ₃ H ₇
30	1584.	CH ₃	CF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1585.	CH ₃	OCF ₃	H	n-C ₃ H ₇
	1586.	CH ₃	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
	1587.	CH ₃	F	H	CH(CH ₃) ₂
	1588.	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
35	1589.	CH ₃	Br	H	CH(CH ₃) ₂
	1590.	CH ₃	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1591.	CH ₃	OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
	1592.	CH ₃	Cl	H	n-C ₄ H ₉
	1593.	CH ₃	F	H	n-C ₄ H ₉
	1594.	CH ₃	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉
40	1595.	CH ₃	Br	H	n-C ₄ H ₉
	1596.	CH ₃	CF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1597.	CH ₃	OCF ₃	H	n-C ₄ H ₉
	1598.	CH ₃	Cl	H	C(CH ₃) ₃
	1599.	CH ₃	F	H	C(CH ₃) ₃
45	1600.	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1601.	CH ₃	Br	H	C(CH ₃) ₃
	1602.	CH ₃	CF ₃	H	C(CH ₃) ₃
	1603.	CH ₃	OCF ₃	H	C(CH ₃) ₃

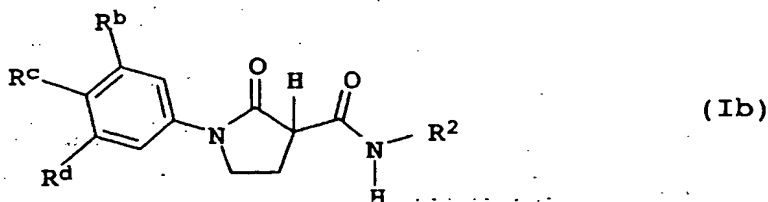
	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
5	1604.	CH ₃	Cl	H	C ₆ H ₅
	1605.	CH ₃	F	H	C ₆ H ₅
	1606.	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅
	1607.	CH ₃	Br	H	C ₆ H ₅
	1608.	CH ₃	CF ₃	H	C ₆ H ₅
10	1609.	CH ₃	OCF ₃	H	C ₆ H ₅
	1610.	CH ₃	Cl	H	Cyclopropyl
	1611.	CH ₃	F	H	Cyclopropyl
	1612.	CH ₃	CH ₃	H	Cyclopropyl
	1613.	CH ₃	Br	H	Cyclopropyl
15	1614.	CH ₃	CF ₃	H	Cyclopropyl
	1615.	CH ₃	OCF ₃	H	Cyclopropyl
	1616.	CH ₃	Cl	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1617.	CH ₃	F	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1618.	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
20	1619.	CH ₃	Br	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1620.	CH ₃	CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1621.	CH ₃	OCF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl
	1622.	CH ₃	Cl	H	Cyclobutyl
	1623.	CH ₃	F	H	Cyclobutyl
25	1624.	CH ₃	CH ₃	H	Cyclobutyl
	1625.	CH ₃	Br	H	Cyclobutyl
	1626.	CH ₃	CF ₃	H	Cyclobutyl
	1627.	CH ₃	OCF ₃	H	Cyclobutyl
	1628.	CH ₃	Cl	H	Cyclopentyl
30	1629.	CH ₃	F	H	Cyclopentyl
	1630.	CH ₃	CH ₃	H	Cyclopentyl
	1631.	CH ₃	Br	H	Cyclopentyl
	1632.	CH ₃	CF ₃	H	Cyclopentyl
	1633.	CH ₃	OCF ₃	H	Cyclopentyl
35	1634.	CH ₃	Cl	H	Cyclohexyl
	1635.	CH ₃	F	H	Cyclohexyl
	1636.	CH ₃	CH ₃	H	Cyclohexyl
	1637.	CH ₃	Br	H	Cyclohexyl
	1638.	CH ₃	CF ₃	H	Cyclohexyl
40	1639.	CH ₃	OCF ₃	H	Cyclohexyl
	1640.	CH ₃	H	Cl	H
	1641.	CH ₃	H	F	H
	1642.	CH ₃	H	CH ₃	H
	1643.	CH ₃	H	Br	H
45	1644.	CH ₃	H	CF ₃	H
	1645.	CH ₃	H	OCF ₃	H
	1646.	CH ₃	H	Cl	CH ₃
	1647.	CH ₃	H	F	CH ₃
	1648.	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
	1649.	CH ₃	H	Br	CH ₃
	1650.	CH ₃	H	CF ₃	CH ₃
	1651.	CH ₃	H	OCF ₃	CH ₃
	1652.	CH ₃	H	Cl	C ₂ H ₅
	1653.	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
	1654.	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅

	Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
	1655.	CH ₃	H	Br	C ₂ H ₅
	1656.	CH ₃	H	CF ₃	C ₂ H ₅
	1657.	CH ₃	H	OCF ₃	C ₂ H ₅
5	1658.	CH ₃	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	1659.	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
	1660.	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
	1661.	CH ₃	H	Br	n-C ₃ H ₇
	1662.	CH ₃	H	CF ₃	n-C ₃ H ₇
	1663.	CH ₃	H	OCF ₃	n-C ₃ H ₇
10	1664.	CH ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	1665.	CH ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
	1666.	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
	1667.	CH ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
	1668.	CH ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
15	1669.	CH ₃	H	OCF ₃	CH(CH ₃) ₂
	1670.	CH ₃	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	1671.	CH ₃	H	F	n-C ₄ H ₉
	1672.	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉
	1673.	CH ₃	H	Br	n-C ₄ H ₉
	1674.	CH ₃	H	CF ₃	n-C ₄ H ₉
20	1675.	CH ₃	H	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
	1676.	CH ₃	H	Cl	C(CH ₃) ₃
	1677.	CH ₃	H	F	C(CH ₃) ₃
	1678.	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
	1679.	CH ₃	H	Br	C(CH ₃) ₃
25	1680.	CH ₃	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃
	1681.	CH ₃	H	OCF ₃	C(CH ₃) ₃
	1682.	CH ₃	H	Cl	C ₆ H ₅
	1683.	CH ₃	H	F	C ₆ H ₅
	1684.	CH ₃	H	CH ₃	C ₆ H ₅
30	1685.	CH ₃	H	Br	C ₆ H ₅
	1686.	CH ₃	H	CF ₃	C ₆ H ₅
	1687.	CH ₃	H	OCF ₃	C ₆ H ₅
	1688.	CH ₃	H	Cl	Cyclopropyl
	1689.	CH ₃	H	F	Cyclopropyl
	1690.	CH ₃	H	CH ₃	Cyclopropyl
35	1691.	CH ₃	H	Br	Cyclopropyl
	1692.	CH ₃	H	CF ₃	Cyclopropyl
	1693.	CH ₃	H	OCF ₃	Cyclopropyl
	1694.	CH ₃	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	1695.	CH ₃	H	F	CH ₂ -Cyclopropyl
	1696.	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
40	1697.	CH ₃	H	Br	CH ₂ -Cyclopropyl
	1698.	CH ₃	H	CF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1699.	CH ₃	H	OCF ₃	CH ₂ -Cyclopropyl
	1700.	CH ₃	H	Cl	Cyclobutyl
	1701.	CH ₃	H	F	Cyclobutyl
45	1702.	CH ₃	H	CH ₃	Cyclobutyl
	1703.	CH ₃	H	Br	Cyclobutyl
	1704.	CH ₃	H	CF ₃	Cyclobutyl
	1705.	CH ₃	H	OCF ₃	Cyclobutyl

Nr.	R ^b	R ^c	R ^d	R ²
1706.	CH ₃	H	Cl	Cyclopentyl
1707.	CH ₃	H	F	Cyclopentyl
1708.	CH ₃	H	CH ₃	Cyclopentyl
1709.	CH ₃	H	Br	Cyclopentyl
1710.	CH ₃	H	CF ₃	Cyclopentyl
1711.	CH ₃	H	OCF ₃	Cyclopentyl
1712.	CH ₃	H	Cl	Cyclohexyl
1713.	CH ₃	H	F	Cyclohexyl
1714.	CH ₃	H	CH ₃	Cyclohexyl
1715.	CH ₃	H	Br	Cyclohexyl
1716.	CH ₃	H	CF ₃	Cyclohexyl
1717.	CH ₃	H	OCF ₃	Cyclohexyl

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ib (\equiv I mit R^a = R^e = H, X = O, Y = O, R¹ = H, R³ = H und n = 0), worin R^b, R^c, R^d und R² die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ib.1 bis Ib.1717, in denen die Variablen R^b, R^c, R^d und R² gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

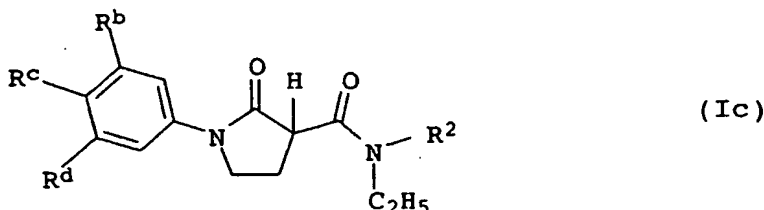
25



30

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ic (\equiv I mit R^a = R^e = H, X = O, Y = O, R¹ = H, R³ = C₂H₅ und n = 0), worin R^b, R^c, R^d und R² die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ic.1 bis Ic.1717, in denen die Variablen R^b, R^c, R^d und R² gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

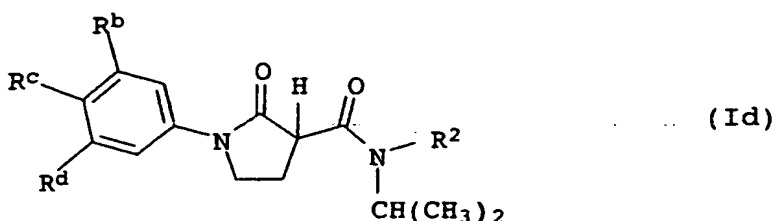


45

55

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Id (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH(CH_3)_2$ und $n = 0$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Id.1 bis Id.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

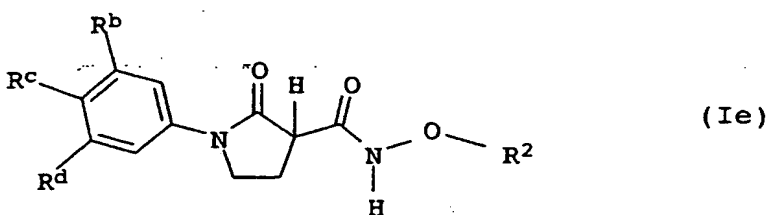
10



15

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ie (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = H$, $A = O$ und $n = 1$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ie.1 bis Ie.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

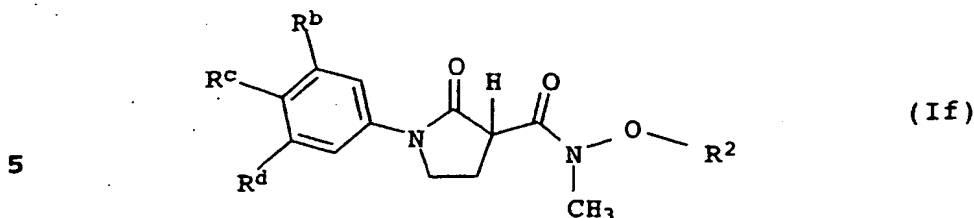
30



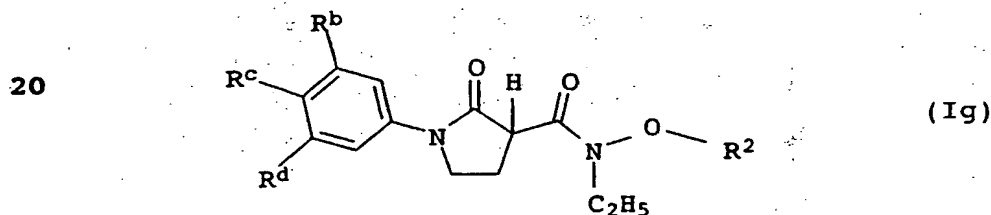
Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel If (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH_3$, $A = O$ und $n = 1$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen If.1 bis If.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

45

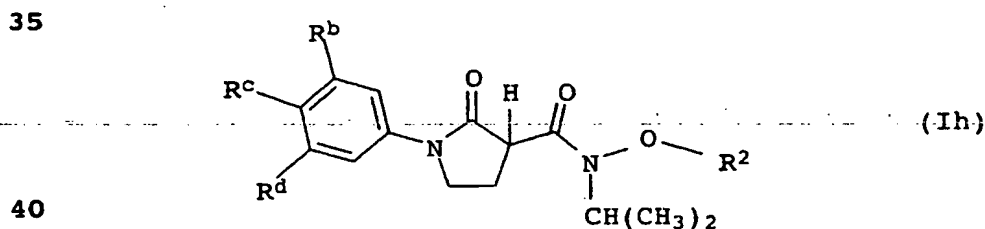
56



Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ig (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = C_2H_5$, $A = O$ und $n = 1$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ig.1 bis Ig.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.



25
30
Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ih (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH(CH_3)_2$, $A = O$ und $n = 1$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ih.1 bis Ih.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

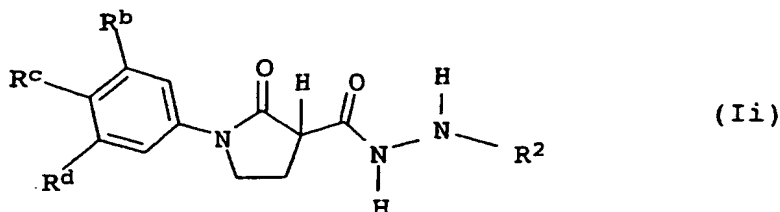


Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ii (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = H$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = H$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind

57

die Verbindungen Ii.1 bis Ii.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

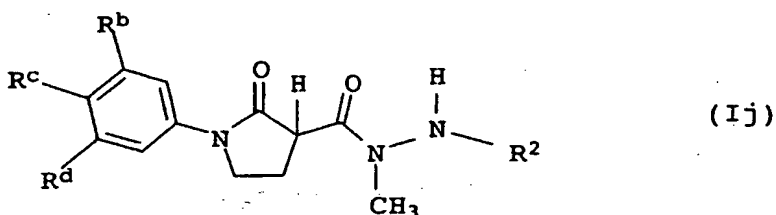
5



10

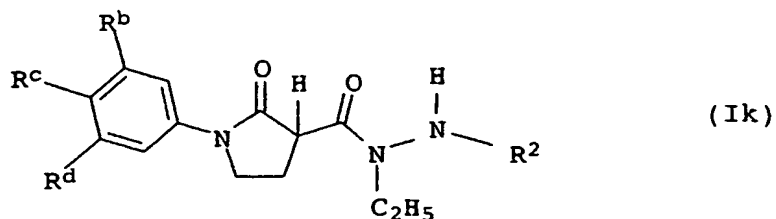
Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ij (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH_3$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = H$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ij.1 bis Ij.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25



30 Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ik (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = C_2H_5$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = H$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind
35 die Verbindungen Ik.1 bis Ik.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

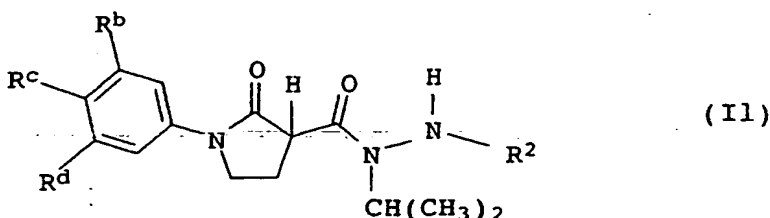


45

58

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel II (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH(CH_3)_2$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = H$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt
 5 genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen II.1 bis II.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

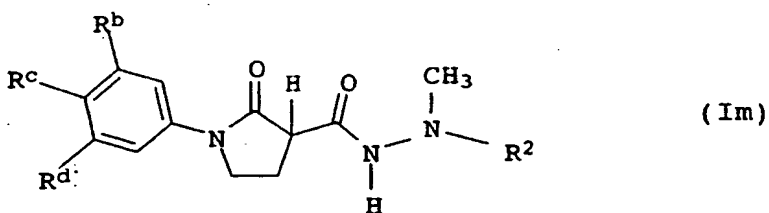
10



15

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Im (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = H$, $n =$
 20 1 und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = CH_3$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Im.1 bis Im.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen
 25 Bedeutungen aufweisen.

30

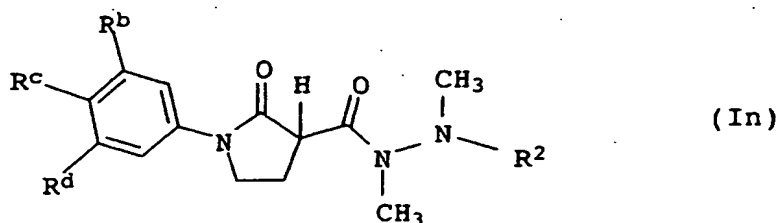


35 Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel In (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH_3$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = CH_3$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind
 40 die Verbindungen In.1 bis In.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

45

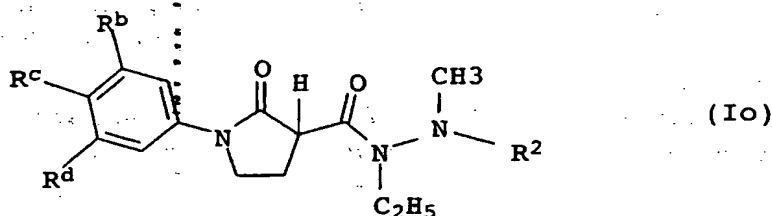
59

5



Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Io (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = C_2H_5$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = CH_3$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Io.1 bis Io.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

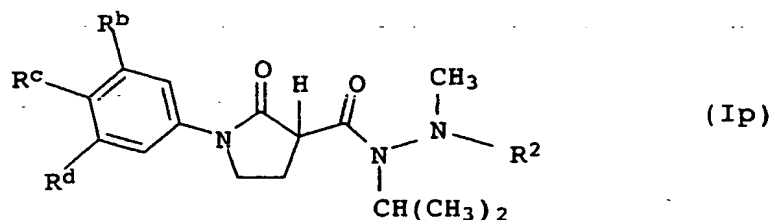


25

Besonders bevorzugt sind auch die 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel Ip (\equiv I mit $X = O$, $Y = O$, $R^1 = H$, $R^3 = CH(CH_3)_2$, $n = 1$ und $A = NR^{12}$ mit $R^{12} = CH_3$), worin R^b , R^c , R^d und R^2 die oben genannten Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen, aufweisen. Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen Ip.1 bis Ip.1717, in denen die Variablen R^b , R^c , R^d und R^2 gemeinsam die in einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40



45

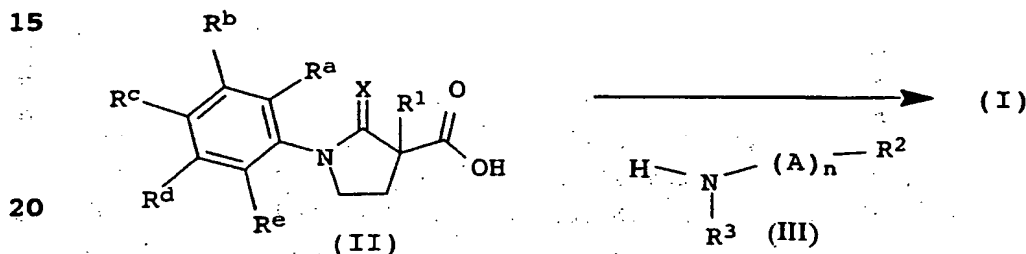
Die erfindungsgemäßen 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der allgemeinen Formel I können beispielsweise nach einem der nachfolgend beschriebenen Verfahren A bis G hergestellt werden.

5

- A) Amidierung einer Carbonsäure II oder eines Carbonsäure-Derivates zu II

Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindung I gelingt beispielsweise gemäß Schema 1 durch Umsetzung einer aktivierten Form einer Pyrrolidin-3-carbonsäure der Formel II mit einem Amin III.

Schema 1:



25 In Schema 1 weisen die Variablen R^1 , X , R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , A , n , R^2 und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen auf. Derartige Umsetzungen sind bekannt, z. B. aus WO 01/83459 und können in analoger Weise auf die in Schema 1 skizzierte Umsetzung übertragen werden. Vorzugsweise aktiviert man zunächst die Carbonsäure II, indem man die Umsetzung in Gegenwart eines Kupplungsmittels durchführt. Als Kupplungsmittel kommen beispielsweise N,N'-Carbonyldiimidazol oder Carbodiimide wie Dicyclohexylcarbodiimid in Betracht. Diese werden in der Regel wenigstens in äquimolarer Menge und bis zu einem vierfachen Überschuss, bezogen auf die Carbonsäure II, eingesetzt. Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung der Carbonsäure II mit dem Kupplungsmittel in Gegenwart einer katalytischen Menge eines tertiären Aminopyridins wie 4-Dimethylaminopyridin (DMAP) durchzuführen. Der Zusatz an Aminopyridin beträgt dann vorzugsweise 5 bis 10 mol-% bezogen auf die Carbonsäure II. Üblicherweise führt man die Umsetzung in einem Lösungsmittel durch. Als Lösungsmittel kommen z. B. chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlor-ethan, Ether z. B. Dialkylether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether oder cyclische Ether wie Tetrahydrofuran oder Dioxan, Carbonsäureamide wie Dimethylformamid, N-Methyl-lactame wie N-Methylpyrrolidon, Nitrile wie Acetonitril, aro-

30

35

40

45

61

matische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, oder Gemische hiervon in Betracht.

5 Das molare Verhältnis von Amin III zu Carbonsäure II beträgt in der Regel wenigstens 0,9:1, vorzugsweise wenigstens 1:1. Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, das Amin in einem geringen Überschuss, beispielsweise in einem bis zu 30%igem Überschuss, bezogen auf die Carbonsäure II, einzusetzen.

10 In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis zur Siedetemperatur des Lösungsmittels.

Alternativ kann man die Carbonsäure II zunächst aktivieren, indem man sie in ihr Säurehalogenid, vorzugsweise ihr Säurechlorid, überführt. Maßnahmen hierfür sind bekannt, z. B. aus US 4,874,422. Geeignet sind anorganische Säurehalogenide, vorzugsweise Säurechloride wie Thionylchlorid, Phosphorylchlorid, Phosphorpentachlorid oder Phosphortrichlorid und organische Säurechloride wie Oxalylchlorid. Man kann das gebildete Säurehalogenid von II isolieren und anschließend mit dem Amin III umsetzen. Das gebildete Säurechlorid von II kann auch ohne Isolierung direkt mit dem Amin III umgesetzt werden. Gegebenenfalls steigert man die Reaktivität des Säurehalogenids durch Zusatz katalytischer Mengen eines Carbonsäuredialkylamids wie Dimethylformamid. Üblicherweise setzt man das Halogenierungsmittel wenigstens in äquimolarer Menge, bezogen auf die Carbonsäure II, ein. Die Säurehalogenide Thionylchlorid, Phosphortrichlorid oder Phosphorylchlorid können gleichzeitig als Lösungsmittel fungieren. Geeignete Lösungsmittel sind ferner unter den Reaktionsbedingungen inerte Lösungsmittel beispielsweise chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol oder Toluol, aliphatische und cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether, Cyclohexan und deren Gemische. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Lösungsmittels. Nach beendeter Umsetzung entfernt man in der Regel den Überschuss an Halogenierungsmittel. Anschließend setzt man das erhaltene Säurehalogenid von II mit dem Amin III um.

35 In der Regel löst man das Amin III in dem Lösungsmittel, das auch zur Herstellung des Carbonsäurehalogenids verwendet wurde, sofern es sich bei dem Lösungsmittel nicht um eines der vorgenannten Säurehalogenide handelt.

45 Gegebenenfalls führt man die Umsetzung in Gegenwart einer Hilfsbase, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuss, bezogen auf Carbonsäure II, ein-

gesetzt wird, durch. Geeignete Basen sind beispielsweise Amine wie 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]non-5-en (DBN), 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU), Pyridin, α -, β -, γ -Lutidin oder Triethylamin.

5

Selbstverständlich können auch andere Verfahren zur Aktivierung der Carbonsäure II verwendet werden. Solche Verfahren sind im Stand der Technik beschrieben, beispielsweise in J. Falbe, Houben Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E5, 4. Aufl., 1985, S. 941 ff.

10

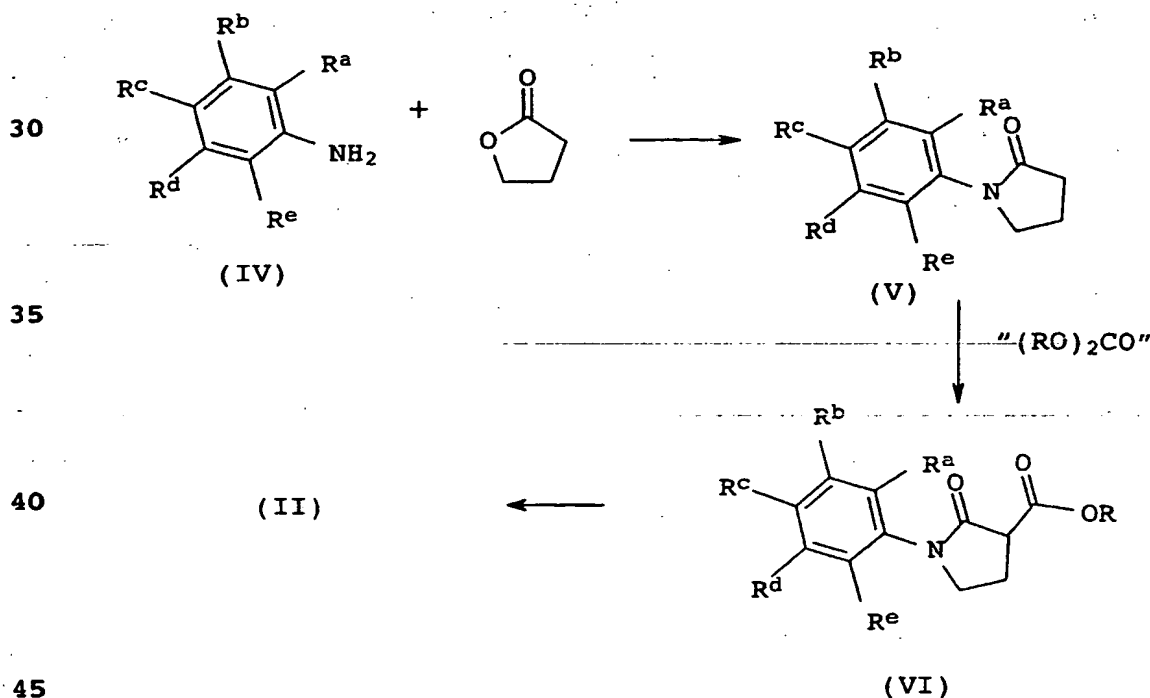
In einer weiteren Verfahrensvariante setzt man den entsprechenden Carbonsäureester von II (Carbonsäureester VI), insbesondere den C₁-C₄-Alkylester von II und speziell den Methyl- oder Ethylester von II mit dem Amin III, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base um. Bezüglich geeigneter Base, Lösungsmittel und Reaktionstemperaturen sei auf das zuvor Gesagte verwiesen. Die Herstellung des Carbonsäureesters VI ist nachfolgend beschrieben.

20

Verbindungen der Formel II mit R¹ = H lassen sich beispielsweise in Anlehnung an ein in Journal of Heterocyclic Chemistry, 3, 311 (1966) beschriebenes Verfahren herstellen. Die Synthese ist in Schema 2 dargestellt.

25

Schema 2:



In Schema 2 haben die Variablen R^a , R^b , R^c , R^d , R^e die zuvor genannten Bedeutungen und R steht für C_1 - C_4 -Alkyl. Die Umsetzung der Anilinverbindung IV mit Butyrolacton erfolgt üblicherweise in Gegenwart einer anorganischen Säure wie Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salzsäure oder in Gegenwart einer organischen Säure wie Essigsäure. Die Umsetzung kann lösungsmittelfrei oder in Gegenwart eines Lösungsmittels erfolgen. Als Lösungsmittel kommen alle unter den Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmittel in Betracht. Vorzugsweise führt man die Umsetzung jedoch lösungsmittelfrei durch. Bei lösungsmittelfreier Durchführung setzt man Butyrolacton in einem Überschuss bezogen auf das Anilin IV ein. Die Reaktionstemperaturen liegen in der Regel im Bereich von 20 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels.

Das erhaltene Pyrrolidinon V wird in der Regel ohne weitere Reinigung im Folgeschritt beispielsweise mit einem Kohlensäureester $(RO)_2CO$ oder einem synthetischen Äquivalent wie Chlорameisensäureester umgesetzt. Hierzu überführt man in der Regel zunächst das Pyrrolidinon V durch Behandlung mit einer geeigneten Base in das entsprechende Enolat. Zu den geeigneten Basen zählen insbesondere lithiumorganische Verbindungen wie n-Butyllithium, tert-Butyllithium und Phenyllithium, Lithiumamide wie Lithiumdiisopropylamid und Alkalimetallhydride wie Natriumhydrid. In der Regel führt man die Umsetzung in einem organischen Lösungsmittel durch. Geeignete Lösungsmittel sind inerte Lösungsmittel wie aliphatische und cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether, Cyclohexan, Ether z. B. Dialkylether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether oder cyclische Ether wie Tetrahydrofuran oder Dioxan sowie Gemische davon. In der Regel wird man die Deprotonierung der Verbindung V bei tiefen Temperaturen bis etwa Raumtemperatur, vorzugsweise etwa 0 °C durchführen. Hierzu setzt man die Base in wenigstens äquimolarer Menge, vorzugsweise in einem 1,1 bis 4-fachen molaren Überschuss, bezogen auf die Verbindung V ein.

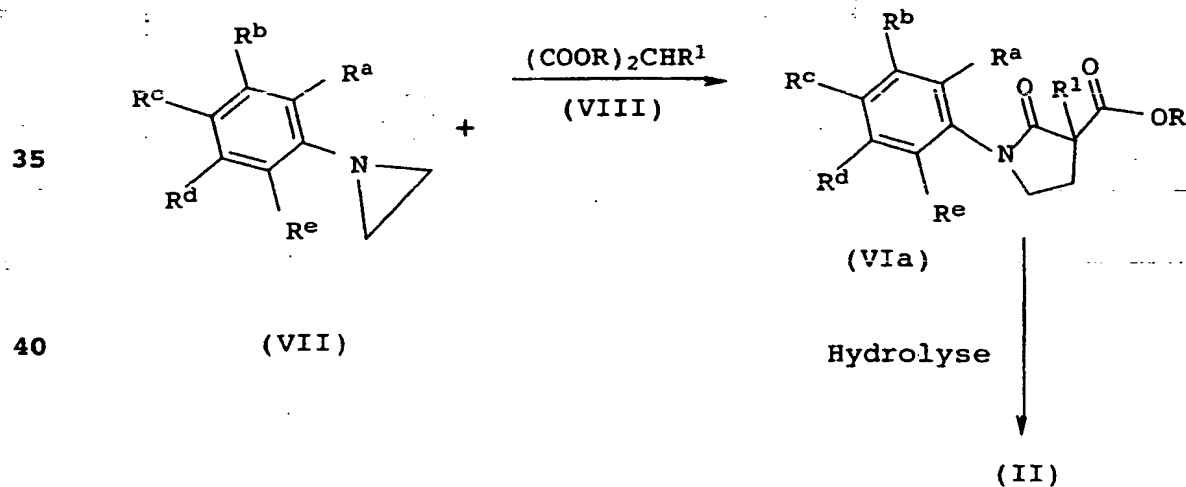
Die anschließende Einführung der Alkoxy-carbonylgruppe gelingt beispielsweise mit einem Kohlensäurediester wie Dimethylcarbonat oder Diethylcarbonat. Üblicherweise setzt man den Kohlensäurediester und das Enolat der Verbindung V in äquimolarer Menge ein. Selbstverständlich kann einer der beiden Reaktanten in einem leichten Überschuss eingesetzt werden. Die zur Umsetzung erforderliche Temperatur liegt in der Regel im Bereich von 0 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels.

Der Carbonsäureester VI wird anschließend nach bekannten Verfahren (siehe z. B. Organikum, 17. Auflage, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 1988, S. 415) zur Carbonsäure II hydrolysiert. Die Hydrolyse kann sowohl im sauren Milieu unter Verwendung von starken Mineralsäuren wie konzentrierte Salzsäure oder Schwefelsäure oder organischen Säuren wie Eisessig oder Gemischen davon in Gegenwart von Wasser als auch im alkalischen Milieu unter Verwendung von Basen wie Alkalihydroxid, beispielsweise Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid gegebenenfalls in Gegenwart von Wasser erfolgen.

Als Lösungsmittel sowohl für die saure als auch für die basische Hydrolyse von Estern kommen beispielsweise Ether z. B. Dialkylether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether oder cyclische Ether wie Tetrahydrofuran oder Dioxan, Alkohole, Wasser und Mischungen dieser Lösungsmittel in Betracht. Die Reaktionstemperatur liegt üblicherweise zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Lösungsmittels.

Die Verbindungen II können außerdem durch Aminoethylierung von Malonsäurediestern VII, worin R^1 die zuvor genannte Bedeutung aufweist und R für C_1 - C_4 -Alkyl steht, mit Phenylazirinen VII und anschließender Hydrolyse hergestellt werden. Die Synthese ist in Schema 3 dargestellt und gelingt in Anlehnung an bekannte Verfahren, wie sie beispielsweise in Archiv der Pharmazie (Weinheim) 302(4), 253 (1969), Justus Liebig's Ann. Chem. (1968), 716, 121 - 126 oder in Angew. Chem. 74, 694 (1962) beschrieben sind.

Schema 3:

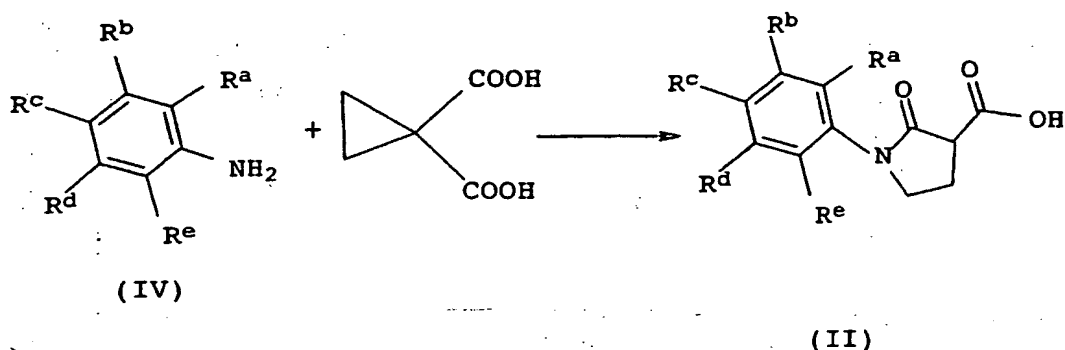


65

Die Umsetzung erfolgt in der Regel in Gegenwart von LiH/LiI in einem Lösungsmittel. Zu den geeigneten Lösungsmitteln zählen aromatische Lösungsmittel wie Benzol, Toluol oder Xylol. Das Aziridin VII und der Malonsäurediester werden häufig in annähernd äquimolarer Menge eingesetzt. Es kann von Vorteil sein, den Malonsäurediester VIII im Überschuss, vorzugsweise in einem bis zu 30%igen Überschuss bezogen auf das Aziridin VII einzusetzen. Der erhaltene Ester VIa wird dann nach bekannten Verfahren durch Hydrolyse im sauren oder alkalischen Milieu in die entsprechenden Carbonsäuren II überführt. Bezüglich der Esterhydrolyse wird auf das zuvor Gesagte Bezug genommen.

Verbindungen der Formel II, worin R¹ für H steht, können außerdem in Anlehnung an ein in JP 2000143624-A beschriebenes Verfahren hergestellt werden. Hierfür setzt man Aniline IV mit 1,1-Cyclopropandicarbonsäure um. Der Syntheseweg ist in Schema 4 dargestellt. Üblicherweise führt man die Umsetzung in Wasser oder in einem aliphatischen Nitril wie Acetonitril oder in Mischungen davon mit Wasser bei Temperaturen zwischen 40 und 100 °C durch.

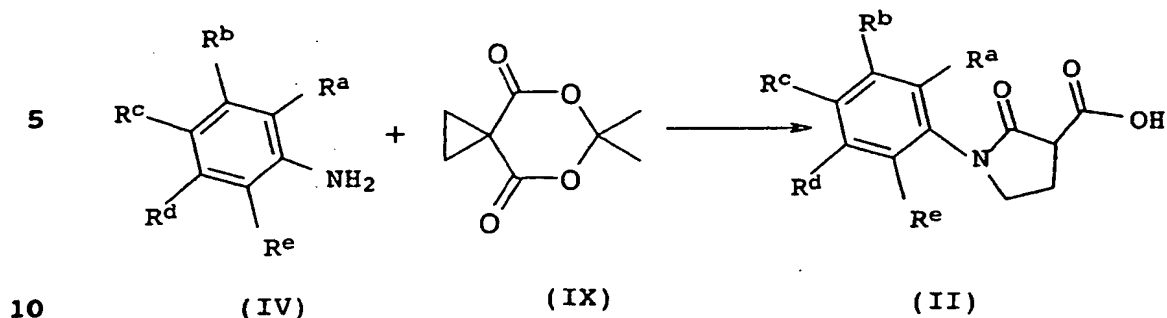
Schema 4:



Verbindungen der Formel II, worin R¹ für H steht, sind des Weiteren in Anlehnung an Verfahren, wie sie in J. Am. Chem. Soc. 97, 3239 (1975) oder Organic Synthesis 60, 66 (1981) beschrieben sind, erhältlich. Die Umsetzung des Anilins IV mit dem Dioxaspirooctandion IX ergibt die Carbonsäure II. Die Syntheseroute ist in Schema 5 dargestellt.

66

Schema 5:



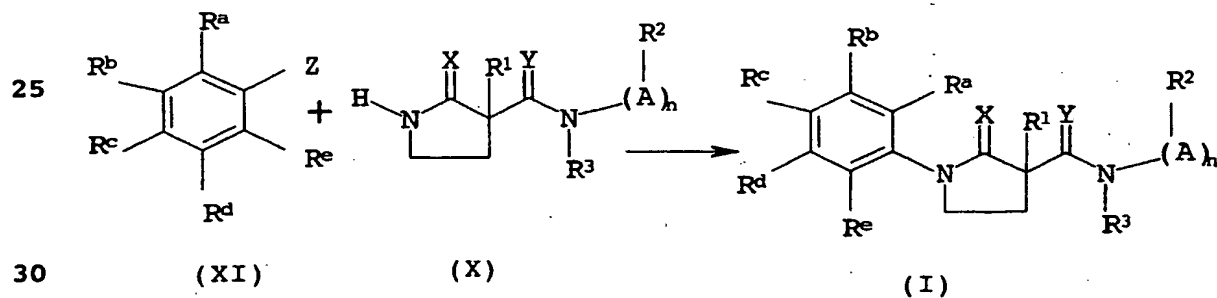
B) Verknüpfung eines Pyrrolidinons X mit einer aromatischen Verbindung XI

15

Verbindungen der Formel I können weiterhin durch Umsetzung von geeignet substituierten Pyrrolidinonen X mit aromatischen Verbindungen der allgemeinen Formel XI nach der im Schema 6 gezeigten Synthese hergestellt werden.

20

Schema 6:



35 In Schema 6 weisen die Variablen R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, X, Y, A, n, R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf. Z steht für Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom, oder für B(OH)₂, B(OR')₂ oder Sn(R')₃. Hierin steht R' für Aryl wie Phenyl oder für C₁-C₁₀-Alkyl.

40 Vorzugsweise erfolgt die Umsetzung in einem Lösungsmittel, insbesondere einem polaren, aprotischen Lösungsmittel wie Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Dimethylacetamid, einem Ether wie Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan sowie Mischungen dieser Lösungsmittel.

45

In der Regel wird man die Umsetzung bei Temperaturen oberhalb Raumtemperatur, vorzugsweise im Bereich von 50 bis 200 °C durchführen. Hierzu setzt man die Verbindungen der allgemeinen Formel X und XI vorzugsweise in annähernd äquimolaren Mengen ein. Selbstverständlich kann man auch eine Komponente im Überschuss einsetzen, wobei der Überschuss vorzugsweise nicht mehr als 50 Mol-%, insbesondere nicht mehr als 20 Mol-%, bezogen auf die im Unterschuss vorliegende Komponente betragen wird.

10

Des Weiteren erhält man die erfindungsgemäßen Verbindungen I durch Kupplung von XI (z.B. Z = Cl, Br, I, B(OR)₂, SnR₃) mit einem Pyrrolidinon X, vorzugsweise in Gegenwart katalytisch aktiver Mengen einer Palladium-, Kupfer- oder Nickelverbindung, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base in einem organischen Lösungsmittel oder einem Gemisch eines Lösungsmittels mit Wasser bei Umgebungstemperatur oder erhöhten Temperaturen. Verfahren zur Kupplung einer Phenylboronsäure sind beispielsweise in der WO 02/42275 beschrieben.

20

Als Palladium-Katalysatoren sind neben Palladium-Carboxylaten wie Palladium(II)acetat auch Palladium-Phosphan-Komplexe wie Tetrakis(triphenylphosphan)palladium, Bis(triphenylphosphan)palladium(II)chlorid, Bis(1,2-diphenylphosphanoethan)palladium(II)chlorid, Bis(1,3-diphenylphosphanopropan)palladium(II)chlorid, Bis(1,4-diphenylphosphanobutan)palladium(II)chlorid und Bis(diphenylphosphano)ferrocenylpalladium(II)chlorid geeignet. Es können aber auch Palladium-Halogenide wie Palladium(II)chlorid mit Phosphinliganden in situ zu den katalytisch aktiven Komplexen umgesetzt werden. Geeignete Phosphinliganden sind z.B. unsubstituierte oder in ortho-, meta- oder para-Position mit Halogen, Alkyl und/oder SO₃H substituierte Arylphosphane wie Triphenylphosphin, 1,2-Bis(diphenylphosphano)ethan, 1,3-Bis(diphenylphosphano)propan, 1,4-Bis(diphenylphosphano)butan, Bis(diphenylphosphano)ferrocen, Hetarylphosphane wie Trisfurylphosphin oder Trispyridylphosphin.

35

Als Ni-Katalysatoren sind Nickel(II)acetylacetonat alleine oder in Verbindung mit den vorstehend genannten Phosphinliganden oder Ni(II)acetylacetonat mit Imidazoliumcarbenliganden, sowie Komplexe von Nickel(II)salzen mit den vorstehend genannten Phosphinliganden z.B. Bis(triphenylphosphin)nickel(II)chlorid, [1,3-Bis(diphenylphosphano)propan]nickel(II)chlorid, [1,4-Bis(diphenylphosphano)butan]nickel(II)chlorid, [1,4-Bis(diphenylphosphano)butan]nik-

45

68

kel(II)chlorid und [Bis(diphenylphosphano)ferrocen]nikkel(II)chlorid geeignet.

5 Als Kupfer-Verbindungen sind insbesondere Cupfer(I)verbindungen wie CuCl, CuBr und dergleichen geeignet.

10 Üblicherweise setzt man den Katalysator in substöchiometrischer Menge, vorzugsweise von 0,001-0,8 Äquivalenten und besonders bevorzugt von 0,01 bis 0,5 Äquivalenten, bezogen auf eingesetztes Pyrrolidinon XI ein.

15 Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Verbindung X zunächst mit einer Base in ihr Salz zu überführen. Geeignete Basen sind beispielsweise Alkalimetallhydride wie Natriumhydrid und -alkoholate wie Natriummethanolat und Natriumethanolat, Lithiumamide wie Lithiumdiisopropylamid sowie Lithiumorganische Verbindungen wie Butyllithium und Phenyllithium.

20 Das Molverhältnis von Verbindung XI zu Verbindung X liegt vorzugsweise im Bereich von 0,95:1 bis 1:1,5.

25 Als Basen sind, soweit erforderlich, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall(hydrogen)carbonate und -phosphate wie NaOH, NaHCO₃, Na₂CO₃, KHCO₃, K₂CO₃, Ba(OH)₂, K₃PO₄, Alkali-, Erdalkali-, Thallium- und Übergangsmetallalkoholate wie Na-Ethanolat, Thalliummethanolat geeignet. Auch Alkalimetallfluoride wie Kaliumfluorid, Cäsiumfluorid, Ammoniumfluoride und Tetrabutylammoniumfluorid sind als Basen geeignet. Die Base wird üblicherweise in etwa stöchiometrischer
30 Menge oder in bis zu 10-fachem Überschuss, bezogen auf Verbindung II eingesetzt.

35 Als Lösungsmittel sind organische Solventien wie DMF, Dimethyl-acetamid, Toluol, Tetrahydrofuran (THF), Dioxan und Dimethoxyethan geeignet. Im Falle der Boronsäurekupplung können die vorgenannten Lösungsmittel auch im Gemisch mit Wasser eingesetzt werden, z.B. im Verhältnis von etwa 5:1 bis 1:5 bevorzugt im Verhältnis von etwa 2:1 bis 1:2 und insbesondere von etwa 1:1.

40

Die Reaktionstemperatur liegt üblicherweise oberhalb der Schmelztemperatur und kann bis Siedetemperatur des Lösungsmittels betragen. Sie liegt vorzugsweise im Bereich zwischen 50 und 150 °C.

45

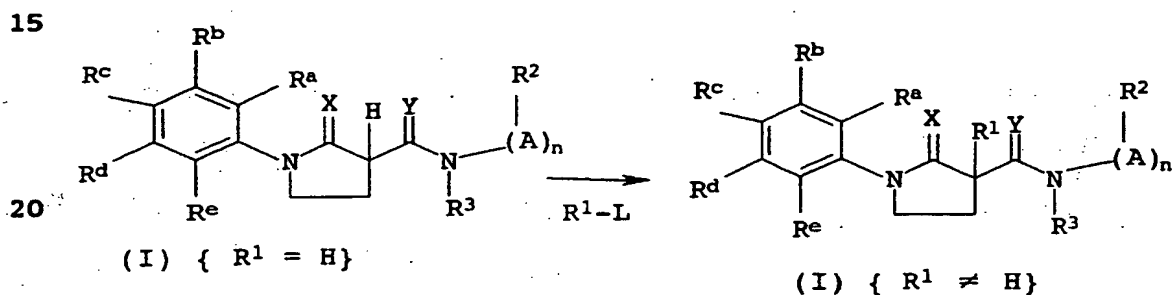
69

Die Pyrrolidinoverbindungen X können nach üblichen Verfahren hergestellt werden, z. B. kann analog zu der in Verfahren A beschriebenen Vorgehensweise.

5 C) Alkylierung von Verbindungen der Formel I, worin $R^1 = H$ ist

Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 für Wasserstoff steht, können nach allgemeinen Methoden durch Behandlung mit einem Alkylierungsmittel R^1-L in Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 nicht für Wasserstoff steht, hergestellt werden. Die Syntheseroute ist in Schema 7 dargestellt.

Schema 7:



25 In Schema 7 weisen die Variablen R^1 , R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , X, Y, A, n, R^1 , R^2 und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen auf. L steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen, z. B. Chlor, Brom, Iod oder für Imidazolyl, Carboxylat wie Acetat, Aryl- oder Alkylsulfonat, z. B. Mesylat oder Tri-

30 flat. Üblicherweise führt man die Umsetzung in Gegenwart einer Base durch. Zu den geeigneten Basen zählen Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, Metallhydride wie Alkalimetallhydride, z. B. Natriumhydrid, tertiäre Alkylamine wie Triethylamin, aromatische Amine wie Pyridin, α -, β -, γ -Lutidin, Lithiumdiisopropylamid.

35

Als Lösungsmittel kommen z. B. chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether wie

40 Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid in Betracht.

In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0

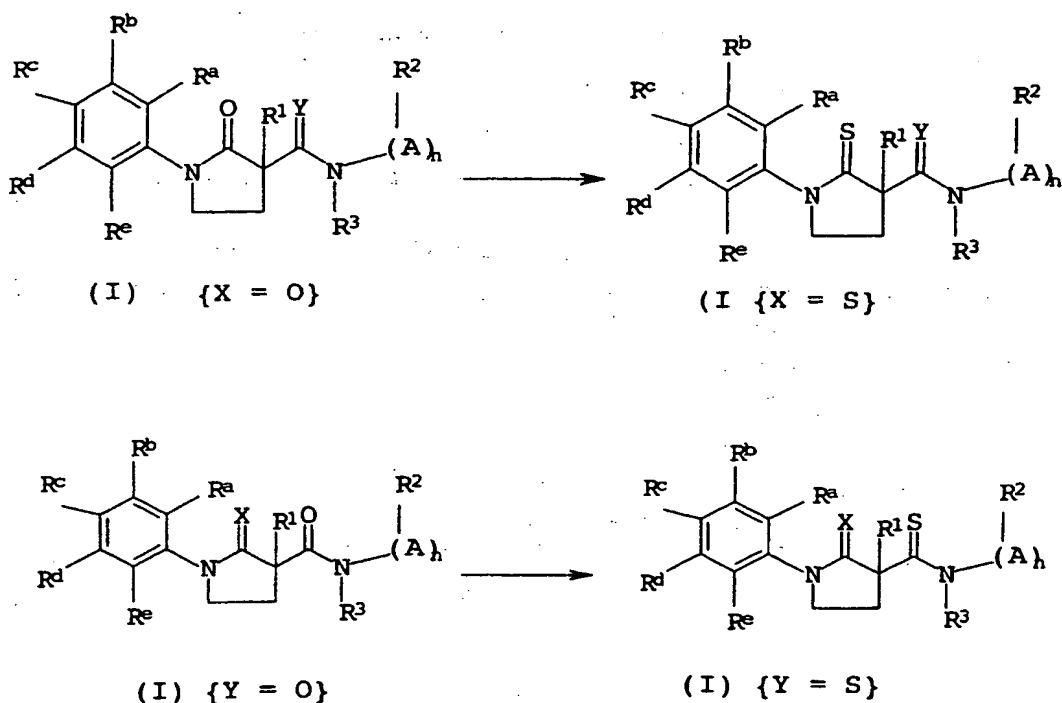
45 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches.

70

- D) Schwefelung der Verbindungen der Formel I, worin X oder Y Sauerstoff bedeutet.

Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X oder Y für Sauerstoff steht, können nach allgemeinen Methoden durch Behandlung mit einem Schwefelungsmittel in Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X oder Y für Schwefel steht, hergestellt werden. Schema 8 veranschaulicht diese Syntheseroute.

Schema 8:



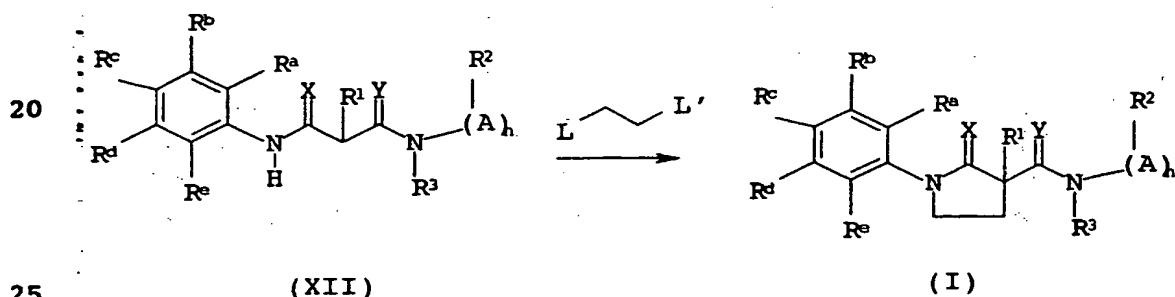
In Schema 8 weisen die Variablen R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, X, Y, A, n, R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf. Beispiele für geeignete Schwefelungsmittel sind Phosphor(V)sulfide, Organozinnsulfide sowie Organophosphorsulfide (siehe auch J. March, Advanced Organic Synthesis, 2nd Edition, Wiley Interscience 1985, S. 794 und dort zitierte Literatur). Besonders geeignete Schwefelungsmittel sind Phosphor(V)-sulfid und 2,4-Bis(4-methoxyphenyl)-1,3,2,4-dithiadiphosphetan-2,4-dithion ("Lawesson-Reagenz"). Verfahren zur Schwefelung sind beispielsweise in der WO 95/33718 beschrieben. Die Umsetzung kann in einem Lösungsmittel oder in Substanz durchgeführt werden. Als Lösungsmittel eignen sich alle Lösungsmittel, die unter den Reaktionsbedingungen inert sind, beispielsweise aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, To-

luol, Xylol, Chlorbenzol, basische Lösungsmittel wie Pyridin, Ether wie Diethylether, 1,2-Dimethoxyethan oder Tetrahydrofuran etc. Die zur Umsetzung erforderlichen Temperaturen liegen in der Regel oberhalb Raumtemperatur und liegen insbesondere im Bereich von 50 °C bis zur Siedetemperatur des Reaktionsgemisches.

E) Kondensation eines Anilids XII

Ein weiterer Zugang zu den erfindungsgemäßen Verbindungen I ist die Umsetzung eines Anilids XII mit einer geeigneten difunktionellen Verbindung $L-CH_2-CH_2-L'$ unter Ringschluss gemäß Schema 9.

Schema 9:



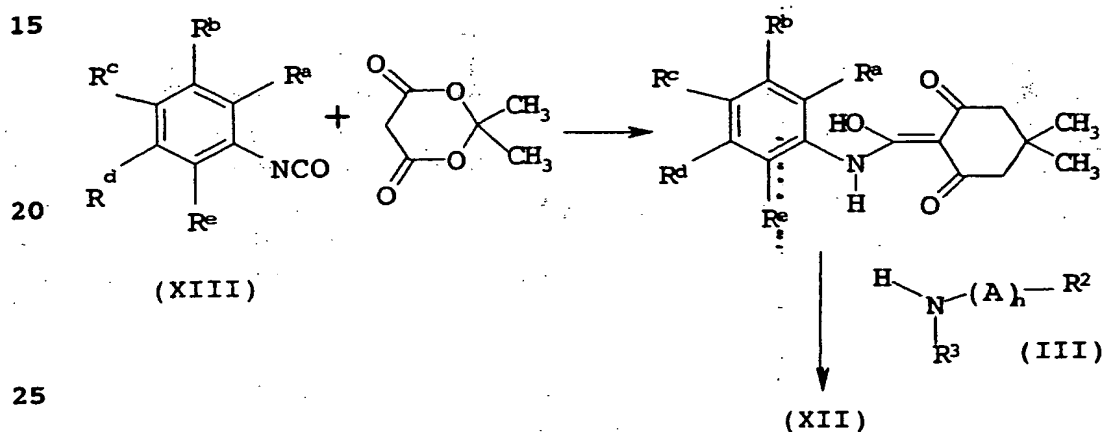
In Schema 9 weisen die Variablen R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , X , Y , A , n , R^1 , R^2 und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen auf, L weist die in C) definierte Bedeutung auf und L' hat die für L genannte Bedeutung.

Die Cyclisierung erfolgt in Gegenwart einer Base. Als Base eignen sich alle unter C) genannten Basen. In der Regel erfolgt die Umsetzung in einem inerten Lösungsmittel. Als Lösungsmittel kommen vor allem chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid in Betracht. Die Ausgangsverbindung XII und die difunktionelle Verbindung $L-CH_2-CH_2-L'$ werden zweckmäßigerweise in etwa äquimolarer Menge eingesetzt; zur Optimierung des Umsatzes kann es jedoch vorteilhaft sein eine der beiden Komponenten im Überschuss zu verwenden. Die Reaktionsführung erfolgt in der Regel bei einer

Temperatur zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Reaktionsgemisches.

Die Ausgangsverbindungen XII lassen sich in Anlehnung an das in Synlett 12, 1209 (1969) beschriebene Verfahren in zwei Schritten herstellen. Im ersten Schritt setzt man ein Isocyanat XIII mit Meldrumsäure (2,2-Dimethyl-1,3-dioxan-4,6-dion) um. Das erhaltene Produkt wird dann im zweiten Schritt mit einem geeigneten Amin III umgesetzt. In Schema 10 weisen die Variablen R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , X , Y , A , n , R^1 , R^2 und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen auf.

Schema 10



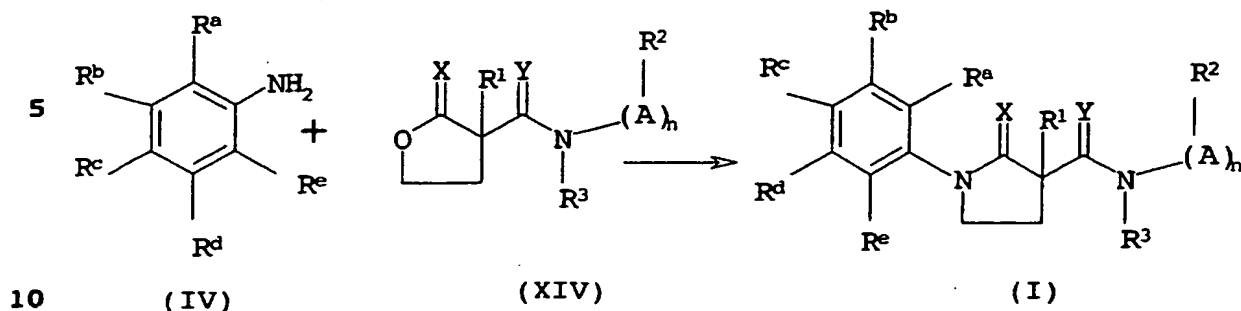
F) Kondensationen

F.1 Kondensation von Anilinen IV mit Tetrahydro-2-furanonen XIV

Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen I gelingt beispielsweise durch Kondensation von Anilinen IV mit Tetrahydro-2-furanonen XIV nach der im Schema 11 dargestellten Syntheseroute. Analoge Umsetzungen sind bekannt, z. B. aus Tetrahedron Letters, 31 (21), 1990, S.2991 und können auf die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen angewendet werden.

73

Schema 11:

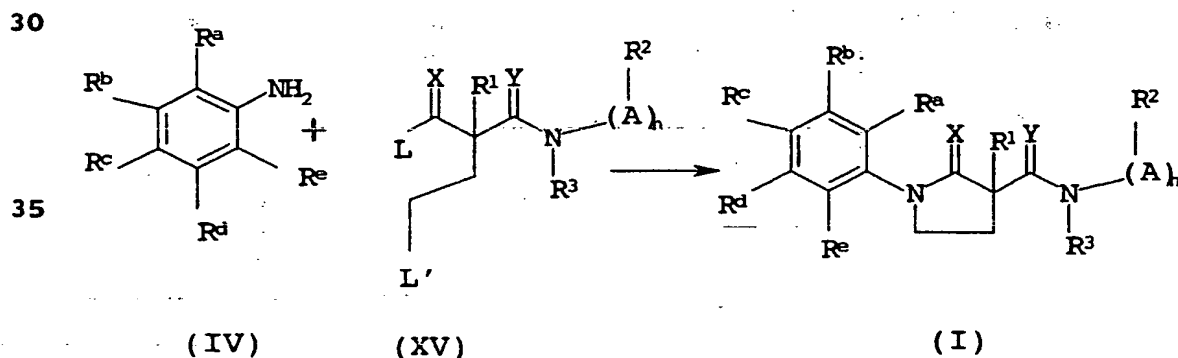


15 In Schema 11 weisen die Variablen R^a, R^b, R^c, R^d, R^d, R^e, X, Y, A, n, R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf. Die Umsetzung der Aniline IV erfolgt üblicherweise in einer Carbonsäure wie Essigsäure bei Temperaturen im Bereich von 0 °C bis 100 °C. In der Regel setzt man die Edukte äquimolar oder eine der beiden Komponenten in einem Überschuss ein.

20 F.2 Kondensation von Anilinen IV mit Carbonsäure-Derivaten XV und anschließender Cyclisierung

25 Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen I gelingt beispielsweise durch Kondensation von Anilinen IV mit Carbonsäure-Derivaten XV nach der im Schema 12 dargestellten Syntheseroute.

Schema 12:



40

45 In Schema 12 weisen die Variablen R^a, R^b, R^c, R^d, R^d, R^e, X, Y, A, n, R¹, R² und R³ die zuvor genannten Bedeutungen auf. L weist die in C) definierte Bedeutung auf und L' hat die für L genannte Bedeutung. Die Umsetzung des Anilins IV mit dem Carbonsäure-Derivat XV erfolgt üblicherweise in Gegenwart einer Base. Geeignete Basen sind beispielsweise Amine wie 1,5-Diä-

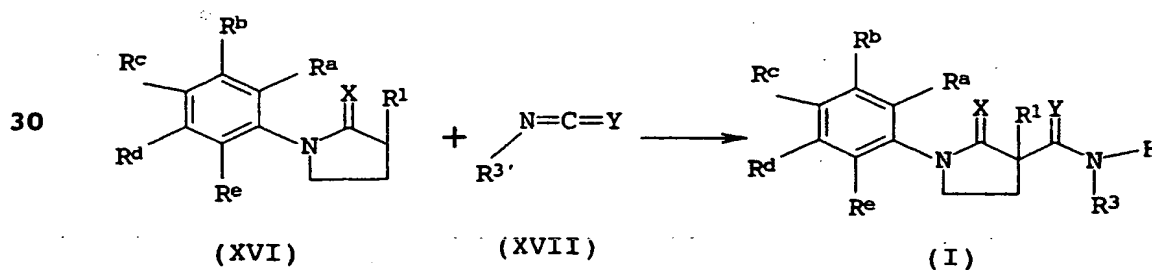
bicyclo[4.3.0]non-5-en (DBN), 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU), Pyridin oder Triethylamin. Üblicherweise setzt man die Base in einem bis zu sechsfachen Überschuss, bezogen auf das Carbonsäure-Derivat XV ein. In der Regel führt man die Umsetzung in einem Lösungsmittel durch. Als Lösungsmittel kommen z. B. chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Ether z. B. Dialkylether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether oder cyclische Ether wie Tetrahydrofuran oder Dioxan, Carbonsäureamide wie Dimethylformamid, N-Methylactame wie N-Methylpyrrolidon, Nitrile wie Acetonitril, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, aromatische Amine wie Pyridin oder Gemische hiervon in Betracht. In der Regel liegt die Reaktionstemperatur in einem Bereich von 0 °C bis zur Höhe des Siedepunktes des Lösungsmittels.

G) Umsetzung eines Pyrrolidinons XVI mit einem Iso(thio)cyanat XVII

Verbindungen der allgemeinen Formel I können durch Umsetzung von Pyrrolidinonen XVI mit einem Iso(thio)cyanat XVII in Gegenwart einer Base nach der im Schema 13 dargestellten Syntheseroute hergestellt werden. Derartige Umsetzungen sind beispielsweise aus der US 5,185,349 bekannt.

25

Schema 13:



35

In Schema 13 weisen die Variablen R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , X , Y und R^1 die zuvor genannten Bedeutungen auf. R^3 weist die für R^3 genannten, von Wasserstoff verschiedenen Bedeutungen auf. Zur Herstellung von Verbindungen I mit $R^3 = H$ wird man vorzugsweise das Salz eines Isocyanats bzw. Isothiocyanats z.B. Natrium- oder Kaliumiso(thio)cyanat einsetzen.

45 Zu den geeigneten Basen zählen Alkalimetallhydride wie Natrium- oder Kaliumhydrid, lithium-organische Verbindungen wie Lithiumdiisopropylamid. In der Regel führt man die Umsetzung in einem Lösungsmittel durch. Zu den geeigneten Lösungsmit-

75

teln zählen Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, 1,4-Dioxan, Anisol, Glykolether wie Dimethylglykolether, Kohlenwasserstoffe wie Hexan, Petrolether oder Gemische davon.

5

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut.

- 10 In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

- 15 In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

20

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis,

- 25 Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium),

- 30 Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus,

- 35 Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba,

- 40 Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

45

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wässrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wässrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, 5 Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Gießen oder Behandlung des Saatgutes bzw. Mischen mit dem Saatgut angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste 10 Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Wirkstoffes der Formel I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsstoffe.

15

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, 20 alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

25

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 30 1-Phenylpyrrolidin-2-on-carboxamide I als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende 35 Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-,

40 Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit 45 Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder

Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykoether, Alkyl-arylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoetheracetat, 5 Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen 10 Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, 15 Kreide, Bolus, Löss, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baum- 20 rinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die 25 Formulierungen enthalten im allgemeinen etwa 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs I. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

30 Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

I. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem 35 Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

II. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer 45 Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctyl-

phenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

III. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

V. 3 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VI. 20 Gewichtsteile einer Verbindung I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natrium Salz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

VII. 1 Gewichtsteil einer Verbindung I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

- VIII. 1 Gewichtsteil einer Verbindung I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl; BASF AG) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Die Applikation der Wirkstoffe I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Es besteht auch die Möglichkeit, die herbiziden Mittel bzw. Wirkstoffe durch zu applizieren, dass mit den herbiziden Mitteln bzw. Wirkstoffen vorbehandeltes Saatgut einer Kulturpflanze ausgebracht wird. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, dass die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

- Die Aufwandmengen an Wirkstoff I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die erfindungsgemäßen Verbindungen I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden.

- Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoessäure und deren Derivate, Benzothiadinazinone, 2-(Hetaroyl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Arylketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidyl-

ether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

- Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein
5 oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von
10 Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, ohne sie einzuschränken.

15

Herstellungsbeispiele

- Die Produkte wurden durch HPLC/MS (High Performance Liquid Chromatography/mass spectrometry (Hochdruckflüssigkeitschromatographie/Massenspektrometrie)), durch ¹H-NMR Spektroskopie oder durch
20 ihren Schmelzpunkt charakterisiert.

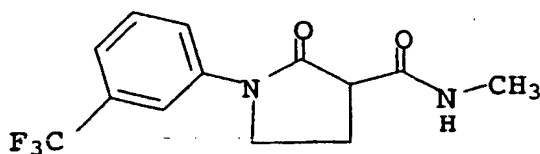
HPLC-Säule: RP-18 Säule (Chromolith Speed ROD von Merck KGaA, Deutschland).

- 25 Eluierungsmittel: Acetonitril + 0,1 % Trifluoressigsäure (TFA)/Wasser + 0,1 % TFA in einem Gradienten von 5:95 bis 95:5 in 5 Minuten bei 40°C.

MS:Quadrupol Elektrospray Ionisation, 80 V (Positivmodus)

- 30 Beispiel 1: 1-(3-Trifluormethyl)phenyl-3-(N-methyl)carboxamido-2-pyrrolidinon

35



40

1.1: 1-(3-Trifluormethyl)phenyl-2-pyrrolidinon

- Man erhitzte 54 g (0,34 mol) 3-Trifluormethylanilin, 110 ml Butyrolacton und 5 ml konzentrierte Salzsäure 13 Stunden am Rück-
45 fluss. Anschließend entfernte man überschüssiges Butyrolacton unter vermindertem Druck. Man wusch den erhaltenen kristallinen Rückstand zunächst mit einer wässrigen Natriumhydrogencarbonat-

Lösung, dann mit Wasser und anschließend mit Pentan. Nach dem Trocknen erhielt man 65,5 g (85 % der Theorie) 1-(3-Trifluormethyl)phenyl-2-pyrrolidinon.

¹H-NMR (270 MHz, CDCl₃) δ (ppm): 7,85 (m, 2H), 7,45 (t, 1H), 7,45 (d, 1H), 3,85 (t, 2H), 2,6 (t, 2H), 2,2 (qu, 2H).

1.2: 2-Oxo-1-(3-trifluormethyl)phenyl-3-pyrrolidincarbonsäure

Zu 13,6 g (0,06 mol) 1-(3-Trifluormethyl)phenyl-2-pyrrolidinon
10 aus 1.1 gab man unter Stickstoff 50 ml absolutes Tetrahydrofuran, kühlte auf 0 °C und versetzte mit 60 ml 2M (0,12 mol) Lithiumdiisopropylamid in einem Lösungsmittelgemisch aus Heptan, Tetrahydrofuran und Ethylbenzol. Das Reaktionsgemisch wurde 45 Minuten bei 0 °C gerührt. Anschließend gab man 5,4 g (0,06 mol) Dimethyl-
15 carbonat in 10 ml absolutem Tetrahydrofuran zu. Nach beendeter Zugabe ließ man das Reaktionsgemisch auf 20 °C erwärmen und rührte das Reaktionsgemisch noch 72 Stunden nach. Nach dem Verdampfen des Lösungsmittels unter vermindertem Druck gab man zum erhaltenen Rückstand Methyl-tert-butylether und Wasser, trennte die Pha-
20 sen und extrahierte die organische Phase zweimal mit Wasser. Man säuerte die wässrige Phase mit Salzsäure (10 Gew.-%) auf pH = 1 an. Man extrahierte zweimal mit je 100 ml Ethylacetat, trocknete die vereinigte organische Phase und engte die organische Phase unter vermindertem Druck ein. Man erhielt auf diese Weise 5,61 g
25 (34 % der Theorie) 2-Oxo-1-(3-trifluormethyl)phenyl-3-pyrrolidincarbonsäure mit Schmelzpunkt 121 °C.

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (ppm): 7,9 (s, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,45 (d, 1H), 4,1 - 3,9 (m, 2H), 3,7 (t, 1H), 2,55 (m, 2H).

30 1.3: 1-(3-Trifluormethyl)phenyl-3-(N-methyl)carboxamido-2-pyrrolidinon

Zu 0,5 g (1,8 mmol) 2-Oxo-1-(3-trifluormethyl)phenyl-3-pyrrolidincarbonsäure aus 1.2 in 50 ml Dichlormethan und 0,35 g (2 mmol)
35 1,1'-Carbonyldiimidazol gab man 0,14 g (1,8 mmol) einer 40%igen wässrigen Methylamin-Lösung. Man rührte das Reaktionsgemisch 18 Stunden bei Raumtemperatur. Man extrahierte das Reaktionsgemisch mit gesättigter wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und extrahierte anschließend die organische Phase mit Wasser. Man trocknete die
40 organische Phase über wasserfreiem Natriumsulfat, entfernte das Lösungsmittel unter vermindertem Druck und verrührte anschließend den verbliebenen Rückstand mit Methyl-tert-butylether. Anschließend trennte man den nicht löslichen Anteil ab und wusch den Rückstand mit Methyl-tert-butylether nach. Man erhielt 0,166 g
45 (32 % der Theorie) der Titelverbindung mit Schmelzpunkt 128 °C.

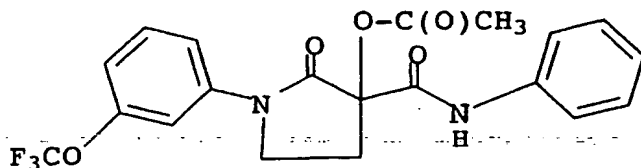
82

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm): 7,9 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,4 (d, 1H), 7,3 - 7,2 (br, 1H), 4,0 - 3,8 (m, 2H), 3,5 (t, 1H), 2,9 (d, 3H), 2,75 - 2,6 (m, 1H), 2,55 - 2,45 (m, 1H).

5 Beispiel 2:

1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-acetyloxy-3-(N-phenyl)carboxamido-2-pyrrolidinon

10



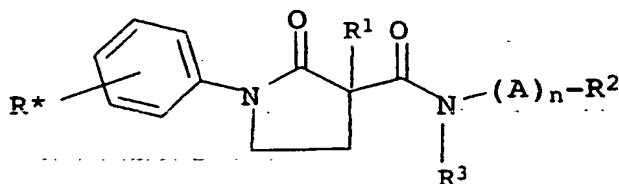
15

Man legte 0,34 g (0,93 mmol) 1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-(N-phenyl)carboxamido-2-pyrrolidinon, hergestellt analog Beispiel 1 unter Verwendung von 3-Trifluormethoxyanilin als Ausgangsmaterial, in 3 ml trockenem Dimethylformamid (DMF) vor und gab bei 20°C 0,04 g (0,093 mmol) Natriumhydrid (60 % in Mineralöl) zu. Anschließend rührte man 30 min. bei 20°C und gab dann 0,07 g (0,093 mmol) Acetylchlorid zu und rührte erneut 18 h bei 20°C. Man gab Wasser zu und extrahierte mehrmals mit Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen, vom Lösungsmittel befreit und der Rückstand wurde chromatographiert. Man erhielt so 0,27 g der Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 140°C.

30 In analoger Weise wurden die Verbindungen der Beispiele 3 bis 191 hergestellt:

Tabelle 2:

35

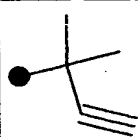
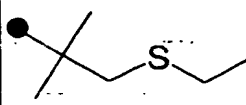
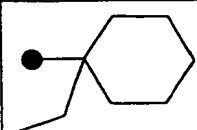
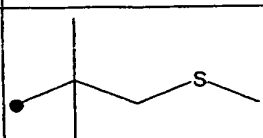


40

45

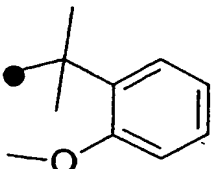
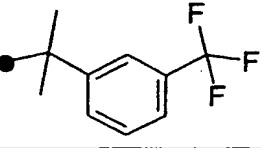
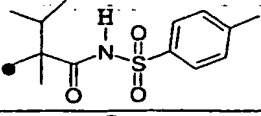
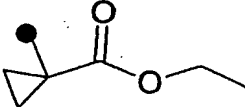
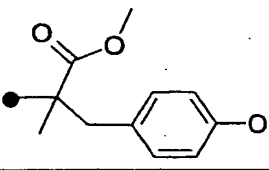
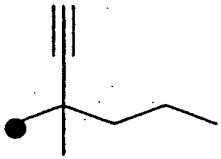
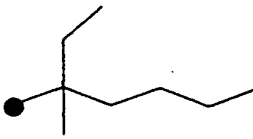
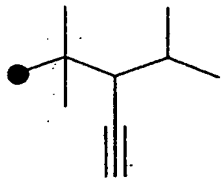
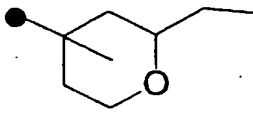
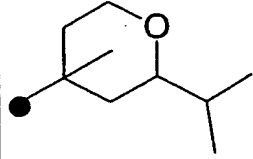
Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
1	-	3-CF ₃	H	Methyl	H	128
2	-	3-OCF ₃	OC(O)CH ₃	Phenyl	H	140

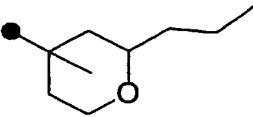
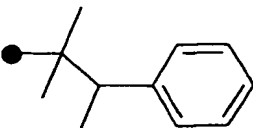
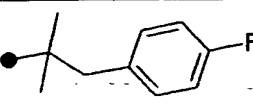

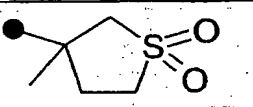
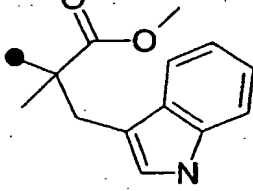
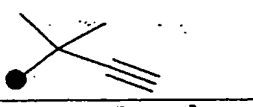
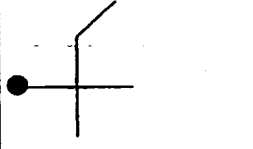
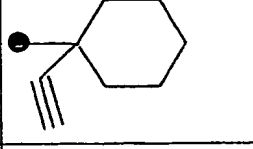

	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	3	-	3-CF ₃	H	Ethyl	H	122
	4	-	3-CF ₃	H	n-Propyl	H	112
	5	-	3-CF ₃	H	n-Butyl	H	111
	6	-	3-CF ₃	H	tert.-Butyl	H	Öl
	7	-	3-CF ₃	H	Cyclopentyl	H	Öl
10	8	-	3-CF ₃	H	Ethyl	Ethyl	Öl
	9	-	3-CF ₃	H	Methyl	n-Butyl	Öl
	10	-	3-CF ₃	H	Phenyl	H	Öl
15	11	-	3-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	H	136
	12	-	3-CF ₃	H	Cyclohexyl	H	141
	13	-	3-CF ₃	H	CH ₂ -Cyclopropyl	H	108
	14	-	3-CF ₃	H	Cyclopropyl	H	Öl
	15	-	3-CF ₃	H	Methyl	Methyl	Öl
20	16	-	3-CF ₃	H	Cyclopropyl	Methyl	Öl
	17	0	3-CF ₃	H	t-Butyl	H	122
	18	-	3-OCF ₃	H	Methyl	H	103
25	19	-	3-OCF ₃	H	Ethyl	H	111
	20	-	3-OCF ₃	H	n-Propyl	H	110
	21	-	3-OCF ₃	H	tert.-Butyl	H	89
	22	-	3-OCF ₃	H	Cyclopentyl	H	140
	23	-	3-OCF ₃	H	Methyl	n-Butyl	Öl
30	24	-	3-OCF ₃	H	Phenyl	H	108
	25	-	3-OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	H	134
	26	-	3-OCF ₃	H	Cyclopropyl	H	134
	27	-	3-OCF ₃	H	Methyl	Methyl	Öl
	28	-	3-OCF ₃	H	H	H	106
35	29	0	3-OCF ₃	H	H	H	124
	30	-	3-OCF ₃	OC(O)CH ₃	Cyclopentyl	H	Öl
	31	0	3-OCF ₃	H	Methyl	H	98
40	32	-	3-OCF ₃	CH ₃	tert.-Butyl	H	40
	33	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ -Phenyl	H	108
	34	0	3-OCF ₃	H	Methyl	Methyl	Öl
	35	0	3-OCF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	H	123
	36	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	75
45	37	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	H	68
	38	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂		29
	39	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH=CHCH ₃	H	87
	40	0	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH=CHCl	H	62

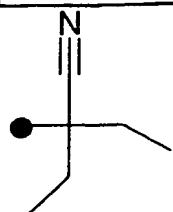
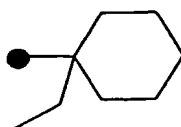
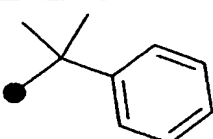

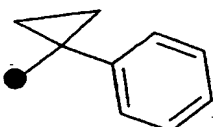
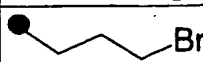
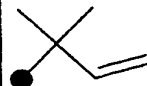
Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)	
5	41	O	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH ₃	H	100
	42	O	3-OCF ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	85
	43	O	3-OCF ₃	H	Cylohexyl	H	152
	44	O	3-OCF ₃	H	CH ₂ -Cylohexyl	H	135
	45	-	3-CH(CH ₃) ₂	H	tert.-Butyl	H	51
10	46	-	3-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	tert.-Butyl	H	78
	47	O	3-CF ₃	H	tert.-Butyl	H	Öl
	48	O	3-OCF ₃	H	tert.-Butyl	H	112
	49	-	2-Cl	H	tert.-Butyl	H	76
	50	-	3-Cl	H	tert.-Butyl	H	118
15	51	-	3-Cl; 5-Cl	H	tert.-Butyl	H	130
	52	-	2-Cl; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	93
	53	-	2-F	H	tert.-Butyl	H	113
	54	-	2-CF ₃	H	tert.-Butyl	H	90
	55	-	4-CF ₃	H	tert.-Butyl	H	155
20	56	-	2-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	93
	57	-	3-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	88
	58	-	4-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	135
	59	-	2-CH(CH ₃) ₂	H	tert.-Butyl	H	104
	60	-	3-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	43
25	61	-	4-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	132
	62	-	2-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	Öl
	63	-	2-Cl; 6-Cl	H	tert.-Butyl	H	Öl
	64	-	2-Cl; 3-Cl	H	tert.-Butyl	H	Öl
	65	-	4-Cl	H	tert.-Butyl	H	155
30	66	-	3-OCH ₃	H		H	110-112
	67	-	3-OCF ₃	H		H	3,78 min, m/z = 405 [M+H] ⁺
	68	-	3-OCF ₃	H		H	4,09 min m/z = 399 [M+H] ⁺
	69	-	3-OCF ₃	H		H	3,62 min m/z = 391 [M+H] ⁺
	40						
45							

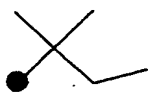
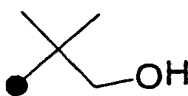
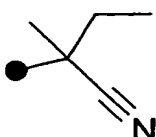
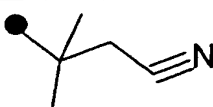
	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	70	-	3-OCF ₃	H		H	3,89 min m/z = 397 [M+H] ⁺
10	71	-	3-OCF ₃	H		H	4,30 min m/z = 469 [M+H] ⁺
15	72	-	3-OCF ₃	H		H	4,03 min m/z = 469 [M+H] ⁺
20	73	-	3-OCF ₃	H		H	3,95 min m/z = 443 [M+Na] ⁺
25	74	-	3-OCF ₃	H		H	3,93 min m/z = 443 [M+Na] ⁺
30	75	-	3-OCF ₃	H		H	3,61 min m/z = 525 [M+H] ⁺
35	76	-	3-OCF ₃	H		H	3,75 min m/z = 459 [M+Na] ⁺
40	77	-	3-OCF ₃	H		H	3,55 min m/z = 489 [M+Na] ⁺
45	78	-	3-OCF ₃	H		H	3,84 min m/z = 373 [M+H] ⁺
	79	-	3-OCF ₃	H		H	4,11 min m/z = 498 [M+Na] ⁺
	80	-	3-OCF ₃	H		H	3,79 min m/z = 443 [M+H] ⁺

	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	81	-	3-OCF ₃	H		H	3,88 min m/z = 373 [M+H] ⁺
10	82	-	3-OCF ₃	H		H	3,60 min m/z = 387 [M+H] ⁺
	83	-	3-OCF ₃	H		H	3,80 min m/z = 429 [M+Na] ⁺
15	84	-	3-OCF ₃	H		H	3,37 min m/z = 355 [M+H] ⁺
20	85	-	3-OCF ₃	H		H	3,17 min m/z = 356 [M+H] ⁺
	86	-	3-OCF ₃	H		H	4,20 min m/z = 401 [M+H] ⁺
25	87	-	3-OCF ₃	H		H	3,55 min m/z = 405 [M+H] ⁺
30	88	-	3-OCF ₃	H		H	3,52 min m/z = 435 [M+H] ⁺
	89	-	3-OCF ₃	H		H	3,91 min m/z = 451 [M+H] ⁺
35	90	-	3-OCF ₃	H		H	4,20 min m/z = 491 [M+Na] ⁺
40	91	-	3-OCF ₃	H		H	3,18 min m/z = 389 [M+H] ⁺

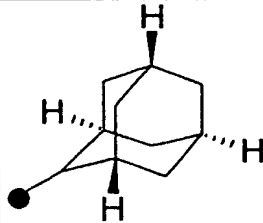
Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5 92	-	3-OCF ₃	H		H	3,85 min m/z = 460 [M+Na] ⁺
10 93	-	3-OCF ₃	H		H	4,03 min m/z = 475 [M+H] ⁺
15 94	-	3-OCF ₃	H		H	3,82 min m/z = 579 [M+Na] ⁺
95	-	3-OCF ₃	H		H	3,19 min m/z = 401 [M+H] ⁺
20 96	-	3-OCF ₃	H		H	3,32 min m/z = 481 [M+H] ⁺
25 97	-	3-OCF ₃	H		H	3,75 min m/z = 383 [M+H] ⁺
30 98	-	3-OCF ₃	H		H	4,26 min m/z = 401 [M+H] ⁺
35 99	-	3-OCF ₃	H		H	4,06 min m/z = 411 [M+H] ⁺
40 100	-	3-OCF ₃	H		H	3,54 min m/z = 415 [M+H] ⁺
45 101	-	3-OCF ₃	H		H	3,79 min m/z = 429 [M+H] ⁺

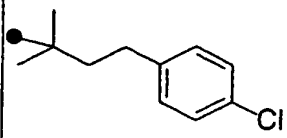
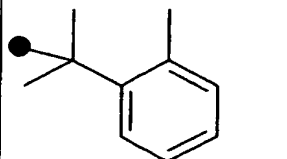
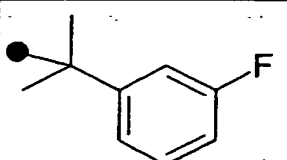
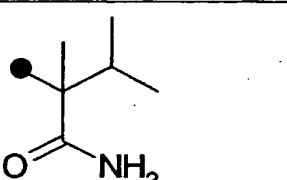
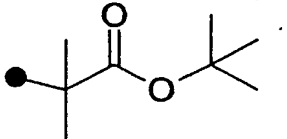
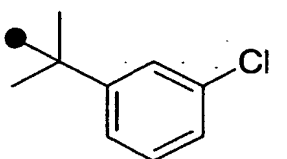
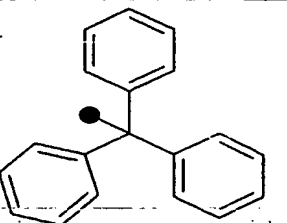
	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	102	-	3-OCF ₃	H		H	3,77 min m/z = 429 [M+H] ⁺
10	103	-	3-OCF ₃	H		H	4,09 min m/z = 435 [M+H] ⁺
	104	-	3-OCF ₃	H		H	3,98 min m/z = 439 [M+H] ⁺
15	105	-	3-OCF ₃	H		H	3,75 min m/z = 383 [M+H] ⁺
20	106	-	3-OCF ₃	H		H	2,93 min m/z = 421 [M+H] ⁺
25	107	-	3-OCF ₃	H		H	3,63 min m/z = 504 [M+H] ⁺
	108	-	3-OCHF ₂	H	Phenyl	H	104
30	109	-	3-OCHF ₂	H		H	80
	110	-	3-OCHF ₂	H	tert.-Butyl	H	64
35	111	-	3-OCHF ₂	H		H	Öl
	112	-	3-OCHF ₂	H		H	153
40	113	-	3-OCHF ₂	H		H	Öl
45							

	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	114	-	3-OCHF ₂	H		H	Öl
10	115	-	3-OCHF ₂	H		H	48
15	116	-	3-OCHF ₂	H		H	Öl
20	117	-	3-OCHF ₂	H		H	82
25	118	-	3-OCHF ₂	H		H	Öl
30	119	-	3-OCHF ₂	H	CH ₃	H	74
	120	-	3-OCHF ₂	H	Ethyl	H	70
	121	-	3-OCHF ₂	H	Isopropyl	H	126
	122	-	3-OCHF ₂	H	Cylopropyl	H	130
	123	-	4-CH=C(Cl) ₂	H	tert.-Butyl	H	166-167
	124	-	3-CF ₃ ; 5-CF ₃	H	tert.-Butyl	H	135-136
35	125	-	4-SCH ₃	H	tert.-Butyl	H	166-167
	126	-	4-CH(CH ₃) ₂	H	tert.-Butyl	H	130-131
	127	-	4-OCHF ₂	H	tert.-Butyl	H	152-153
40	128	-	3-Cl; 4-Cl; 5-Cl	H	tert.-Butyl	H	160-163
	129	-	3-Br; 5-Br	H	tert.-Butyl	H	140-141
	130	-	4-NO ₂ ; 5-Cl	H	tert.-Butyl	H	152-153
45	131	-	4-OCF ₂ CF ₃	H	tert.-Butyl	H	66-67
	132	-	3-OCF ₃	H		H	Öl
	133	-	3-OCF ₃	H		H	3,51 min m/z = 357 [M+H] ⁺

	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	134	-	3-OCF ₃	H		H	3,67 min m/z = 359 [M+H] ⁺
	135	-	3-OCF ₃	H		H	2,92 min m/z = 361 [M+H] ⁺
10	136	-	3-OCF ₃	H		H	3,31 min m/z = 370 [M+H] ⁺
	137	-	3-OCF ₃	H		H	3,23 min m/z = 370 [M+H] ⁺
20	138	-	3-CF ₃ ; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	3,65 min m/z = 363 [M+H] ⁺
	139	-	3-OCH ₃ ; 5-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	2,87 min m/z = 321 [M+H] ⁺
	140	-	3-SCH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,14 min m/z = 307 [M+H] ⁺
25	141	-	3-tert-Bu- tyl	H	tert.-Butyl	H	3,62 min m/z = 317 [M+H] ⁺
	142	-	O-CH(CH ₃) ₂	H	tert.-Butyl	H	3,24 min m/z = 319 [M+H] ⁺
30	143	-	3-F; 4-F	H	tert.-Butyl	H	3,07 min m/z = 297 [M+H] ⁺
	144	-	3-OCH ₃ ; 4-OCH ₃ ; 5-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	2,64 min m/z = 351 [M+H] ⁺
35	145	-	4-Propyl	H	tert.-Butyl	H	3,53 min m/z = 303 [M+H] ⁺
	146	-	4-O-tert- Butyl	H	tert.-Butyl	H	3,36 min m/z = 333 [M+H] ⁺
40	147	-	3-Cl; 4-F	H	tert.-Butyl	H	3,26 min m/z = 313 [M+H] ⁺
	148	-	4-O-Propyl	H	tert.-Butyl	H	3,67 min m/z = 319 [M+H] ⁺
45	149	-	4-Br	H	tert.-Butyl	H	3,19 min m/z = 339 [M+H] ⁺

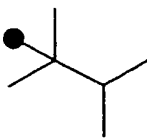
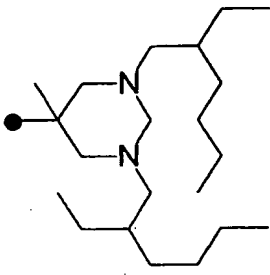
	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	150	-	4-SCH ₂ CH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,32 min m/z = 321 [M+H] ⁺
	151	-	3-Br; 4-OCH ₃ ; 5-Cl	H	tert.-Butyl	H	3,49 min m/z = 405 [M+H] ⁺
10	152	-	3-Cl; 4-O-Propyl	H	tert.-Butyl	H	3,58 min m/z = 353 [M+H] ⁺
	153	-	3-F; 4-NO ₂	H	tert.-Butyl	H	2,97 min m/z = 324 [M+H] ⁺
15	154	-	3-Br; 5-Br; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	3,86 min m/z = 452 [M+H] ⁺
	155	-	3-Ethyl; 5-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,47 min m/z = 303 [M] ⁺
20	156	-	3-CH ₃ ; 5-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,22 min m/z = 289 [M+H] ⁺
	157	-	3-Br	H	tert.-Butyl	H	3,21 min m/z = 341 [M+H] ⁺
25	158	-	3-Ethyl	H	tert.-Butyl	H	3,23 min m/z = 289 [M+H] ⁺
	159	-	3-Isopro- pyl; 4-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,46 min m/z = 333 [M+H] ⁺
30	160	-	3,4 -OCH ₂ CH ₂ O-	H	tert.-Butyl	H	2,66 min m/z = 319 [M+H] ⁺
35	161	-	4-CN	H	tert.-Butyl	H	2,74 min m/z = 286 [M+H] ⁺
	162	-	3-CN; 4-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	2,74 min m/z = 316 [M+H] ⁺
40	163	-	3-CN; 4-F	H	tert.-Butyl	H	2,79 min m/z = 304 [M+H] ⁺
	164	-	3-F; 4-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,22 min m/z = 293 [M+H] ⁺
45	165	-	3-CN; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	3,09 min m/z = 320 [M+H] ⁺

	Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5	166	-	3-Cl; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	3,53 min m/z = 329 [M] ⁺
	167	-	3-CH ₃ ; 4-F	H	tert.-Butyl	H	3,11 min m/z = 293 [M+H] ⁺
10	168	-	3-Cl; 4-OCH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,06 min m/z = 325 [M+H] ⁺
	169	-	4-Heptyl	H	tert.-Butyl	H	4,50 min m/z = 359 [M+H] ⁺
15	170	-	4-tert.- Butyl	H	tert.-Butyl	H	3,73 min m/z = 317 [M+H] ⁺
	171	-	4-Ethyl	H	tert.-Butyl	H	3,32 min m/z = 289 [M+H] ⁺
20	172	-	3-Cl; 4-Isopro- pyl	H	tert.-Butyl	H	3,82 min m/z = 337 [M+H] ⁺
	173	-	3-Cl; 4-CH ₃	H	tert.-Butyl	H	3,45 min m/z = 309 [M] ⁺
25	174	-	3-F	H	tert.-Butyl	H	3,96 min m/z = 279 [M+H] ⁺
	175	-	3-CH ₃ ; 5-Propyl	H	tert.-Butyl	H	94-96
30	176	-	3-Ethyl; 5-Ethyl	H	tert.-Butyl	H	120-122
	177	-	3-O-Ethyl	H	tert.-Butyl	H	86-88
	178	-	3-OCH ₃ ; 4-Br	H	tert.-Butyl	H	150-152
35	179	-	3-OCH ₃ ; 4-Cl	H	tert.-Butyl	H	137-139
	180	-	3-Cl; 4-SCF ₃	H	tert.-Butyl	H	3,86 min m/z = 395 [M+H] ⁺
40	181	-	4-F	H	tert.-Butyl	H	2,77 min m/z = 278 [M+H] ⁺
	182	-	3-OCF ₃	H		H	4,16 min m/z = 423 [M+H] ⁺
45							

Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5 183	-	3-OCF ₃	H		H	4,31 min m/z = 469 [M+H] ⁺
10 184		3-OCF ₃	H		H	3,87 min m/z = 443 [M+H] ⁺
15 185	-	3-OCF ₃	H		H	3,76 min m/z = 447 [M+Na] ⁺
20 186	-	3-OCF ₃	H		H	3,00 min m/z = 402 [M+H] ⁺
25 187	-	3-OCF ₃	H		H	3,75 min m/z = 453 [M+Na] ⁺
30 188	-	3-OCF ₃	H		H	3,94 min m/z = 463 [M+Na] ⁺
35 189	-	3-OCF ₃	H		H	4,42 min m/z = 553 [M+Na] ⁺

40

45

Bs.	(A) _n	R*	R ¹	R ²	R ³	Smp. [°C] oder RT (HPLC/MS)
5 190	-	3-OCF ₃	H		H	3,85 min m/z = 473 [M+Na] ⁺
10 191	-	3-OCF ₃	H		H	4,49 min m/z = 611 [M+Na] ⁺

* Die Zahl vor dem Substituenten bezeichnet die Position des Substituenten am Phenylring.

• Verknüpfungsstelle

20

Bs. = Beispiel
RT = Retentionszeit, HPLC/MS
Smp. = Schmelzpunkt
Phenyl = C₆H₅

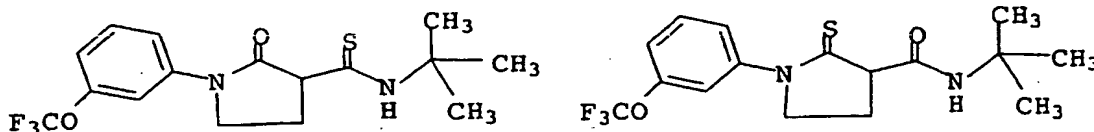
25

Beispiel 192:

1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-(N-(1,1-dimethylethyl))carboxamido-2-pyrrolidinthion und 1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-

30 (N-(1,1-dimethylethyl))thiocarboxamido-2-pyrrolidinon

35



40 Man legte 0,26 g (0,7 mmol) 1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-(N-(1,1-dimethylethyl))carboxamido-2-pyrrolidinon in 3 ml trockenem Toluol vor und gab bei 20°C 0,17 g (0,42 mmol) 2,4-Bis(4-methoxyphenyl)-1,3-dithia-2,4-diphosphetan-2,4-dithion (Lawesson-Reagenz) zu und erwärmte 7 h auf 70°C. Anschliessend

45 wurde die Reaktionsmischung 2 mal mit Wasser gewaschen. Man entfernte das Lösungsmittel und chromatographierte den Rückstand an Kieselgel, wobei man eine Mischung aus Cyclohexan/Ethylacetat als

Eluenten verwendete. In einer ersten Fraktion erhielt man 0,06 g (22 %) 1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-(N-(1,1-dimethylethyl))-thiocarboxamido-2-pyrrolidinon mit einem Schmelzpunkt von 65°C und 0,08 g (29 %) 1-(3-Trifluormethoxy)phenyl-3-(N-(1,1-dimethylethyl))-carboxamido-2-pyrrolidinthion mit einem Schmelzpunkt von 116°C.

Anwendungsbeispiele

- 10 Die herbizide Wirkung der 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastiktöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0% Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach

- 15 Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um
20 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

25

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder di-
30 rekt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Vor und Nachauflaufbehandlung betrug 3.0 kg a. S./ha.

- 35 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

40

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

45

96

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Bayercode	Deutscher Name	Englischer Name
5 ABUTH	Chinesischer Hanf	Velvetleaf
AVEFA	Flughafer	wild Oat
LOLMU	italienisches Raygras	italien Ryegrass
SETIT	Borstenhirse	Millet
SINAL	weißer Senf	velvetleaf

10

Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 3 bei Nachauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AVEFA und SINAL.

15 Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 18 bei Nachauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, SETIT und SINAL.

Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 20 18 bei Voraufauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, SETIT und SINAL.

Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 25 19 bei Voraufauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH und SINAL.

Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 26 bei Nachauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AVEFA und SINAL.

30

Bei Aufwandmengen von 3 kg/ha zeigt die Verbindung aus Beispiel 26 bei Voraufauflaufanwendung eine sehr gute herbizide Wirkung gegen ABUTH, LOLMU und SINAL.

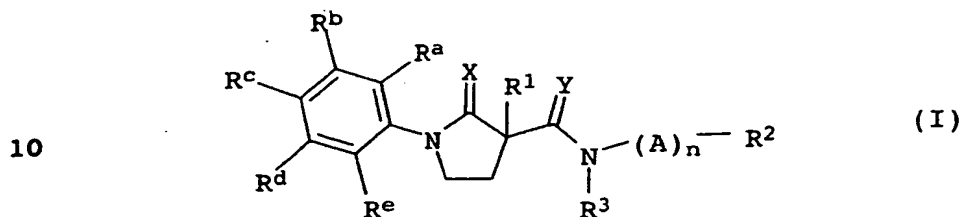
35

40

45

Patentansprüche

1. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide der allgemeinen
 5 Formel I



15 worin die Variablen R^1 , R^2 , R^3 , X, Y, A, n, R^a , R^b , R^c , R^d und R^e folgende Bedeutung haben:

- R^1 Wasserstoff, OH, Cl, Br, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, $C(O)R^4$ oder $OC(O)R^4$;
- 20 R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, C_7 - C_{10} -Polycycloalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Alkinyl, C_5 - C_{10} -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, Phenyl oder 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl, wobei die 9 letztgenannten Gruppen unsubstituiert, teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Reste, ausgewählt unter OH, CN, NO_2 , COOH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, $COOR^5$, NR^6R^7 , $C(O)NR^8SO_2R^{13}$, $C(O)NR^8R^9$ und 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl aufweisen können und jedes Heterocyclyl 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel, einer Gruppe NR^{10} und einer Gruppe SO_2 , sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann und/oder einen anellierten Phenylring aufweisen kann, der gegebenenfalls substituiert ist; oder
- 35 R^2 und R^3 mit der Gruppe $N-(A)_n$, an die sie gebunden sind, einen gesättigten, 3 bis 7 gliedrigen Heterocyclus bilden, der neben dem Stickstoffatom 1, 2 oder weitere 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel und einer Gruppe NR^{10} sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann;
- 40
- 45

5 R^a , R^b , R^c , R^d und R^e unabhängig voneinander Wasserstoff, OH, CN, NO_2 , Halogen, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, $\text{C}(\text{O})\text{R}^4$, COOR^5 , NR^6R^7 , $\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{11}$ oder C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl; oder

10 zwei benachbarte Reste R^a bis R^e bilden gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring, der ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff, Sauerstoff, Schwefel und einer Gruppe NR^{10} als ringbildendes Atom enthalten kann und/oder ein, zwei, drei oder vier
15 Reste ausgewählt unter Halogen und C_1 - C_4 -Alkyl tragen kann;

X, Y unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel;

20 n 0 oder 1;

A O, $\text{S}(\text{O})_k$ oder NR^{12} , worin k für 0, 1 oder 2;

25 R^4 , R^8 , R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl ;

R^5 , R^{11} C_1 - C_4 -Alkyl;

R^6 , R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, $\text{C}(\text{O})\text{R}^4$, COOR^5 oder $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{11}$;

30 R^{10} , R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkinyl; und

35 R^{13} Phenyl, das unsubstituiert ist oder eine 1, 2, 3 oder 4 Substituenten trägt, wobei die Substituenten ausgewählt sind unter Halogen, Nitro, Cyano, OH, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, COOR^5 , NR^6R^7 und $\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$;

sowie die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I.

40

2. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach Anspruch 1, worin R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_8 -Alkinyl, C_5 - C_{10} -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, Phenyl oder 3 bis 7 gliedriges Heterocyclyl, wobei die 8 letztgenannten Gruppen unsubstituiert, teilweise oder vollständig halogeniert sein
45 können und/oder 1, 2 oder 3 Reste, ausgewählt unter OH, CN,

- NO₂, COOH, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹ aufweisen können und Heterocycl 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel und einer Gruppe NR¹⁰ sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann; oder
- 10 R² und R³ mit der Gruppe N-(A)_n, an die sie gebunden sind, einen gesättigten, 3 bis 7 gliedrigen Heterocyclus bilden, der neben dem Stickstoffatom 1, 2 oder weitere 3 Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff, Schwefel und einer Gruppe NR¹⁰ sowie gegebenenfalls 1, 2 oder 3 Carbonylgruppen und/oder Thiocarbonylgruppen als Ringglieder aufweisen kann.
- 15 3. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach Anspruch 1 oder 2, worin R¹ Wasserstoff bedeutet.
- 20 4. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet.
- 25 5. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R² für C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl, Phenyl C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, wobei C₁-C₆-Alkyl teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen Rest, ausgewählt unter C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, COOR⁵, NR⁶R⁷, C(O)NR⁸R⁹ aufweisen kann.
- 30 6. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin X und Y für Sauerstoff stehen
- 35 7. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin n = 0 ist.
- 40 8. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin die Reste R^a, R^b, R^c, R^d und R^e ausgewählt sind unter Wasserstoff, Halogen, CN, C₁-C₄-Alkyl, OCH₃, CF₃, CHF₂, OCF₃ und OCHF₂.
- 45 9. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin nicht mehr als 3 der Reste R^a, R^b, R^c, R^d und R^e von Wasserstoff verschieden sind.

10. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin 2 oder 3 der Reste R^a , R^b , R^c , R^d und R^e von Wasserstoff verschieden sind.
- 5 11. 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamide nach Anspruch 9 oder 10, worin die Reste R^a und R^e für Wasserstoff stehen.
12. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamids der Formel I oder
10 eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.
- 15 13. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, dass man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 1-Phenylpyrrolidin-2-on-3-carboxamids der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche auf Pflanzen,
20 deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken lässt.

25

30

35

40

45